

## (12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2001年6月14日 (14.06.2001)

PCT

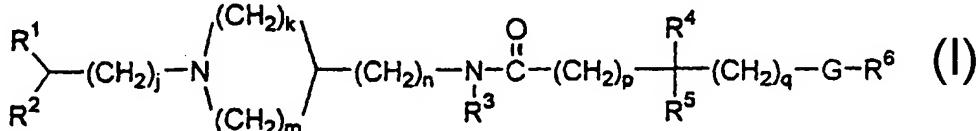
(10)国際公開番号  
WO 01/42208 A1

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 207/09,  
211/26, 405/12, 409/12, 401/12, 401/04, 409/14, 405/14,  
401/14, 401/06, 413/06, 413/14, 409/06
- (21) 国際出願番号: PCT/JP00/08627
- (22) 国際出願日: 2000年12月6日 (06.12.2000)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願平11/348778 1999年12月8日 (08.12.1999) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 帝人株式会社 (TEIJIN LIMITED) [JP/JP]; 〒541-0054 大阪府大阪市中央区南本町1丁目6番7号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 塩田辰樹
- (SHIOTA, Tatsuki) [JP/JP]. 横山朋典 (YOKOYAMA, Tomonori) [JP/JP]. 上村 孝 (KAMIMURA, Takashi) [JP/JP]; 〒191-0065 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 前田純博(MAEDA, Sumihiro); 〒100-0011 東京都千代田区内幸町2丁目1番1号 帝人株式会社 知的財産センター内 Tokyo (JP).
- (81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許

[続葉有]

(54) Title: CYCLOAMINE CCR5 RECEPTOR ANTAGONISTS

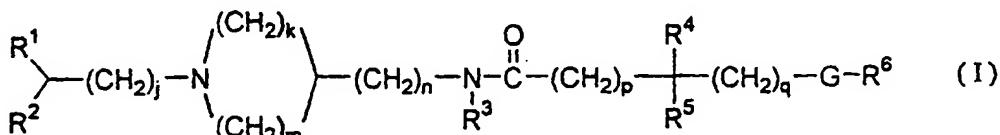
(54)発明の名称: 環状アミンCCR5レセプター拮抗剤



(57) Abstract: Therapeutic or preventive agents for CCR5-related diseases such as AIDS, rheumatoid arthritis and nephritis, containing as the active ingredient cycloamine derivatives of general formula (I), pharmaceutically acceptable adducts of the same with acids, or pharmaceutically acceptable adducts thereof with C<sub>1-6</sub> alkyl.

(57)要約:

下記式(I)で表される環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル付加体を有効成分として含有する、エイズ、慢性関節リウマチ、腎炎などの、CCR5が関与する疾患の治療剤または予防剤。



WO 01/42208 A1



(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

## 明細書

## 環状アミンCCR5レセプター拮抗剤

## 5 技術分野

本発明は、慢性関節リウマチ、腎炎（腎症）、多発性硬化症、臓器移植後の拒絶反応、移植片対宿主病（G V H D）、糖尿病、慢性閉塞性肺疾患（C O P D）、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、および炎症性腸疾患など、単球／マクロファージ、T細胞などの組織への浸潤、活性化が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患、またはH I V（ヒト免疫不全ウイルス）の感染に起因するエイズ（A I D S：後天性免疫不全症候群）に対する治療薬および／または予防薬として効果が期待できるCCR5拮抗剤に関する。

15

## 背景技術

CCR5レセプターは、M I P - 1  $\alpha$  (macrophage inflammatory protein-1 $\alpha$ の略称)、M I P - 1  $\beta$  (macrophage inflammatory protein-1 $\beta$ の略称)、R A N T E S (regulated upon activation normal 20 T-cell expressed and secretedの略称) のレセプターであり、胸腺や脾臓などのリンパ組織、単球／マクロファージ、T細胞などに発現していることが知られている（例えば、Samson, M. et al., Biochemistry, 1996, 35, 3362; Raport, C. J. et al., J. Biol. Chem., 1996, 27 1, 17161; Combadiere, C. et al., J. Leukoc. Biol., 1996, 60, 1 25 47など参照）。

CCR5レセプターと疾患との関連に関する知見としては、慢性関節リウマチ患者の関節滑膜組織および滑液中のT細胞などの白血球にCCR5が発現していること（Loetscher, P. et al., Nature, 1998, 391, 344; Mack, M. et al., Arthritis Rheum., 1999, 42, 981など参考）、CCR5欠損ホモ接合体は慢性関節リウマチ患者中には認められなかったこと（Gomez-Reino, J. J. et al., Arthritis Rheum., 1999,

42, 989参照）、糸球体腎炎、間質性腎炎、移植後の拒絶反応患者の腎生検サンプル中のT細胞にCCR5が発現していること（Segerer, S. et al., Kidney Int., 1999, 56, 52参照）、多発性硬化症患者の血液中にはCCR5を発現しているT細胞が多く認められること（Balashov, 5 K.E., Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 1999, 96, 6873参照）、マウス移植片対宿主病（GVHD）モデルの肝炎症部に浸潤したT細胞にはCCR5が発現しており、このT細胞の浸潤は抗CCR5抗体投与により抑制されること（Murai, M. et al., J. Clin. Invest., 1999, 104, 49参照）、マウス糖尿病モデルにおける病態の進展にMIP-1 $\alpha$ および 10 CCR5が関与していること（Cameron, M.J. et al., J. Immunol., 2000, 165, 1102参照）などが報告されている。

したがって、CCR5は、単球／マクロファージおよび／またはT細胞が病変部位に集積し、活性化されることが病変の進展に深く関わっていると想定され得る疾患、例えば慢性関節リウマチ、腎炎（腎症）、多発性硬化症、臓器移植後の拒絶反応、移植片対宿主病（GVHD）、および糖尿病などの発症、進展、維持に深く関与していると考えられる。 15

さらに、CCR5はT細胞の中でも特にTh1細胞に特異的に発現しているとの報告があることから、上記疾患も含めてTh1細胞が病態に関与することが想定され得る慢性閉塞性肺疾患（COPD）、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、および炎症性腸疾患など多くの自己免疫疾患および炎症性疾患の発症、進展、維持に関わっていると考えられる（Bonecchi, R. et al., J. Exp. Med., 1998, 187, 129; Loetscher, P. et al., Nature, 1998, 391, 344など参照）。 20

一方、HIV（ヒト免疫不全ウイルス）が宿主細胞に感染する際のレセプターとしてはCD4が知られていたが、このCD4だけではHIVの感染は成立しないことから、第2のレセプター（コレセプターまたはセカンドレセプター）が必要であることが示唆されていた。一般に、HIV-1は感染可能な細胞の種類により、マクロファージ指向性（M-tropic）株、T-細胞指向性（T-tropic）株に大別されるが、マクロファージ指向性株の感染に必須のコレセプターがCCR5 25

であることが明らかにされた（例えば、Deng, H. et al., *Nature*, 1996, 381, 661; Dragic, T. et al., *Nature*, 1996, 381, 667; Alkhalib, G. et al., *Science*, 1996, 272, 1955; Choe, H. et al., *Cell*, 1996, 85, 1135; Doranz, B.J. et al., *Cell*, 1996, 85, 1149参考）。

したがって、HIV-1がCCR5に結合することを阻害する薬剤は、新たなエイズ（AIDS：後天性免疫不全症候群）治療薬および／または予防薬として有効であると考えられる（Michael, N.L. et al., *Nature Med.*, 1999, 5, 740; Proudfoot, A.E.I. et al., *Biochem. Pharmacol.*, 1999, 57, 451; 村上ら *蛋白質核酸酵素*, 1998, 43, 677など参照）。これを裏付ける知見として、CCR5のリガンドであるRANTES、MIP-1 $\alpha$ 、MIP-1 $\beta$ がHIV-1感染の抑制因子であること（Cocchi, F. et al., *Science*, 1995, 270, 1811参考）、CCR5遺伝子の32塩基対の欠損により正常なCCR5がまったく発現していない人はHIV-1感染に抵抗性を有するとともに、この欠損は他の健康上の異常を引き起こさないこと（Liu, R. et al., *Cell*, 1996, 86, 367; Samson, M. et al., *Nature*, 1996, 382, 722; Dean, M. et al., *Science*, 1996, 273, 1856など参照）、抗CCR5モノクローナル抗体がマクロファージ指向性HIV-1の末梢血単核球への感染を抑制すること（Wu, L. et al., *J. Exp. Med.*, 1997, 185, 1681参考）、アミノ末端を欠損もしくは修飾したRANTESはRANTESの拮抗剤となり、マクロファージ指向性HIV-1の感染を抑制すること（Arenzana-Seisdedos, F. et al., *Nature*, 1996, 383, 400; Proost, P. et al., *J. Biol. Chem.*, 1998, 273, 7222; Simmons, G. et al., *Science*, 1997, 276, 276など参照）などが報告されている。

以上のことから、CCR5の生体内リガンドであるMIP-1 $\alpha$ 、MIP-1 $\beta$ 、またはRANTESのCCR5への結合、もしくはエイズの病原ウイルスであるHIV-1のCCR5に対する結合を阻害する化合物、すなわちCCR5拮抗剤は、CCR5の生体内リガンドの標的細胞への作用、もしくはエイズウイルスの宿主細胞への感染を阻害することにより、エイズ、慢性関節リウマチ、腎炎（腎症）、多発性硬化症、

臓器移植後の拒絶反応、移植片対宿主病（G V H D）、糖尿病、慢性閉塞性肺疾患（C O P D）、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、または炎症性腸疾患などの疾患の治療薬および／もしくは予防薬として有用であると考えられる。

- 5 最近、置換ビスーアクリジン誘導体（国際公開WO 9 8 3 0 2 1 8号参照）、置換アニリド誘導体（国際公開WO 9 9 0 1 1 2 7号；国際公開WO 0 0 0 6 0 8 5号；国際公開WO 0 0 0 6 1 4 6号；国際公開WO 0 0 0 6 1 5 3号；国際公開WO 0 0 4 0 2 3 9号；国際公開WO 0 0 4 2 8 5 2号参照）、置換アルケン酸アニリド誘導体（国際公開WO 10 9 9 3 2 1 0 0号；国際公開WO 0 0 1 0 9 6 5号；国際出願WO 0 0 3 7 4 5 5号；Baba, et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 1999, 96, 5698参照）、3-(4-ピペリジニル)インドール誘導体（国際公開WO 9 9 1 7 7 7 3号；国際公開WO 0 0 4 2 0 4 5号参照）、アザシクロアルカン誘導体（E P 1 0 1 3 2 7 6号；国際出願WO 0 0 15 8 6 8 0号；国際出願WO 0 0 3 9 1 2 5号参照）、ベンゾジビラン誘導体（国際公開WO 0 0 5 3 1 7 5号参照）、およびピロリジン誘導体（国際公開WO 0 0 5 9 4 9 7号；国際公開WO 0 0 5 9 4 9 8号；国際公開WO 0 0 5 9 5 0 2号；国際公開WO 0 0 5 9 5 0 3号参照）が、CCR 5 レセプターに対する拮抗活性を有することが報告されている。
- 10 しかしながら、これらの化合物は、本発明で用いる化合物とは異なる。一方、本発明で用いる化合物は、国際公開WO 9 9 2 5 6 8 6号に記載されている化合物と同一のものであるが、これらの化合物がCCR 5 レセプターに対する拮抗活性を有することは知られていなかった。
- 15

## 25 発明の開示

本発明の目的は、CCR 5に対する結合を阻害する活性を有する低分子化合物、すなわちCCR 5 拮抗剤を提供することである。

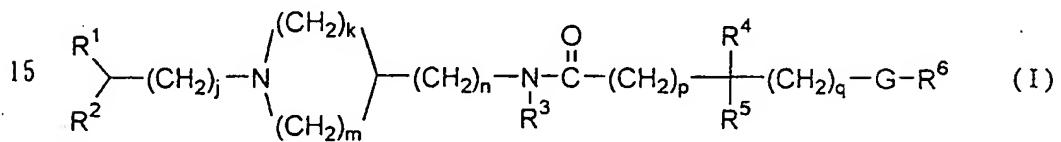
- また、R A N T E SなどのCCR 5の生体内リガンドが標的細胞上のCCR 5に結合することを阻害する活性、もしくはエイズの病原ウイルスであるH I V-1のCCR 5に対する結合を阻害する活性を有する低分子化合物を提供することである。
- 30

さらに、本発明の目的は、CCR5の生体内リガンドが標的細胞上のCCR5に結合することが病因の一つであるような疾患の治療法および／または予防法を提供することである。

さらに、本発明の目的は、HIVの感染に起因するエイズの治療法および／または予防法を提供することである。

本発明者らは銳意研究を重ねた結果、アリールアルキル基を有する環状アミン誘導体、その薬学的に許容し得るC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体、または薬学的に許容され得る酸付加体が、CCR5拮抗活性を有することを発見し、さらにはそれらの化合物が、CCR5が関与すると考えられる疾患の治療薬もしくは予防薬となり得ることを知見して研究を進めた結果、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明によれば、下記式(I)



[式中、R<sup>1</sup>はフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していくてもよく、さらに上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アル

カノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  N-アルキルカルバモイル基、 $C_4 \sim C_9$  N-シクロアルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_3 \sim C_8$  (アルコキシカルボニル) メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ビペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式： $-NH(C=O)O-$ で表される2価基、式： $-NH(C=S)O-$ で表される2価基、アミノ基、モノ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基、またはジ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基で置換されていてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。

$R^2$ は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表し、 $R^2$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、 $j = 0$ のときは、 $R^2$ はヒドロキシ基ではない。

$j$ は0～2の整数を表す。

$k$ は0～2の整数を表す。

$m$ は2～4の整数を表す。

$n$ は0または1を表す。

$R^3$ は、水素原子、または(それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基)によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。

$R^4$ および $R^5$ は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、 $R^4$ および $R^5$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、

5 グアニジノ基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、(任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基)、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、いっしょになって3～6員環状炭化水素を形成していてもよい。

10 pは0または1を表す。

15 qは0または1を表す。

Gは、-CO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-O-、-NR<sup>7</sup>-CO-、-CO-NR<sup>7</sup>-、-NH-CO-NH-、-NH-CS-NH-、-NR<sup>7</sup>-SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>7</sup>-、-NH-CO-O-、または-O-CO-NH-で表される基を表す。ここで、R<sup>7</sup>は、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基を表すか、あるいはR<sup>7</sup>はR<sup>5</sup>といっしょになってC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基を形成していてもよい。

20 R<sup>6</sup>は、フェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R<sup>6</sup>におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していてもよく、さらに上記R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシル基、カルバモイル

基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N,N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>(アルコキシカルボニル)アミノ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>(アルキルスルホニル)アミノ基、またはビス(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル)アミノ基により置換されていてもよく、これらのフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、またはジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。]

で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体を有効成分とする、CCR5拮抗作用を有する薬剤が提供される。

さらに、本発明によれば、上記式(I)で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体を有効成分とする、CCR5が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬が提供される。

ここに、上記式(I)で表される化合物は、CCR5拮抗活性、およびCCR5の生体内リガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する活性を有する。すなわち、上記式(I)で表される化合物はCCR5拮抗剤である。

### 発明を実施するための最良の形態

上記式(I)において、R<sup>1</sup>はフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>4</sub>～C<sub>9</sub>N-シクロアルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>(アルコキシカルボニル)メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ビペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式：-NH(C=O)O-で表される2価基、式：-NH(C=S)O-で表される2価基、アミノ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、またはジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基で置換されていてもよい。

R<sup>1</sup>における「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロビル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、およびシクロオクチル基などの環状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、シクロプロビル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>における、「ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基」とは、例えば、チエニ

ル、フリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、トリアジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル（フラザニル）、チアジアゾリル基などの芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、チエニル、フリル、ピロリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、およびピリジル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>における「縮合環」とは、上記フェニル基または芳香族複素環基が、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と可能な任意の位置で縮合して形成される2環式芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、ナフチル、インドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル（ベンゾフラザニル）、およびベンゾチアジアゾリル基などが挙げられる。

なかでもR<sup>1</sup>は、フェニル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イソオキサゾリル基、またはインドリル基である場合が特に好みい。

R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としての「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などを意味し、その好適な具体例としてはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基」とは、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、イソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペニチル、イソヘキシル、2-メチルペンチル、1-エチルブチル基などのC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>の直鎖または分枝状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、およびtert-ブチル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基」は、前記R<sup>1</sup>における「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基」の定義と同様であり、その好適

な具体例も同じ基を挙げることができる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基」とは、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-メチル-1-プロペニル、4-ペンテニル、5-ヘキセニル、4-メチル-3-ペンテニル基などのC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>の直鎖または分枝状のアルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、ビニル基および2-メチル-1-プロペニル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシ基、エトキシ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基とチオ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基」とは、例えば、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、および1-メチルトリメチレン基などのC<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>の2価のアルキレン基を意味し、その好適な具体例としては、トリメチレン基、テトラメチレン基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンオキシ基」とは、例えば、エチレンオキシ(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-)、トリメチレンオキシ(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-)、テトラメチレンオキシ(-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-)、1,1-ジメチルエチレンオキシ(-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>O-)基などの、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>の2価アルキレン基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、エチレンオキシ基、トリメチレンオキシ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基」とは、例えば、メチレンジオキシ(-OCH<sub>2</sub>O-)、エチレンジオキシ(-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-)、トリメチレンジオキシ(-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-)、プロピレンジオキシ(-OCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)O-)基などのC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>の2価アルキレン基と2個のオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基」とは、例えば、アセチル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、イソブチリル、3-メチルブタノイル、2-メチルブタノイル、ピバロイル、4-メチルペンタノイル、3, 3-ジメチルブタノイル、5-メチルヘキサノイル基などのC<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>の直鎖または分枝状のアルカノイル基を意味し、その好適な具体例としては、アセチル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基とカルボニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基」とは、前記C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としてはアセチルオキシ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基」とは、前記C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、アセチルアミノ基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルキルカルバモイル基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、N-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>4</sub>～C<sub>9</sub> N-シクロアルキルカルバモイル基」とは、前記C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基とスルホニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルスルホニル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>(アルコキシカルボニル)メチル基」とは、前記C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基とメチル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、(メトキシカルボニル)メ

チル基、(エトキシカルボニル)メチル基などが挙げられる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基などが挙げら  
5 れる。

R<sup>1</sup>の置換基としての「ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基」とは、同一または異なった2つの前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基などが挙げられる。

10 上記の中でも、R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンオキシ基、アルキレンジオキシ基、アセチ  
15 ル基、フェニル基、アミノ基、およびジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基を特に好ましい具体例として挙げることができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基、メチレンジオキシ基、およ  
びアミノ基を挙げができる。

20 さらに、R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、もしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基によって置換されていてもよい。ここで、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、およびC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコ  
25 キシ基は、前記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ基を好適な具体例として挙げができる。

上記式(I)において、R<sup>2</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表  
30 し、R<sup>2</sup>におけるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、もしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>

アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、 $j = 0$  のときは、 $R^2$  はヒドロキシ基ではない。

$R^2$  における  $C_1 \sim C_6$  アルキル基および  $C_2 \sim C_7$  アルコキシカルボニル基は、 $R^1$  におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基についてそれぞれ定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

$R^2$  における  $C_1 \sim C_6$  アルキル基またはフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基および  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基は、前記  $R^1$  におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基について定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

なかでも  $R^2$  は、水素原子を表す場合が特に好ましい。

上記式 (I) において、 $j$  は  $0 \sim 2$  の整数を表す。 $j$  は  $0$  である場合が特に好ましい。

上記式 (I) において、 $k$  は  $0 \sim 2$  の整数を表し、 $m$  は  $2 \sim 4$  の整数を表す。なかでも  $k$  が  $0$  で  $m$  が  $3$  である場合の 2-置換ピロリジン、 $k$  が  $1$  で  $m$  が  $2$  である場合の 3-置換ピロリジン、 $k$  が  $1$  で  $m$  が  $3$  である場合の 3-置換ピペリジン、 $k$  が  $2$  で  $m$  が  $2$  である場合の 4-置換ピペリジン、または  $k$  が  $1$  で  $m$  が  $4$  である場合の 3-置換ヘキサヒドロアゼビンが好ましい。特に好ましくは、 $k$  が  $1$  で  $m$  が  $2$  である場合の 3-置換ピロリジンおよび  $k$  が  $2$  で  $m$  が  $2$  である場合の 4-置換ピペリジンを挙げができる。

上記式 (I) において、 $n$  は  $0$  または  $1$  を表す。

特に、 $k$  が  $1$  で  $m$  が  $2$  で  $n$  が  $0$  である場合の 3-アミドピロリジン、および  $k$  が  $2$  で  $m$  が  $2$  で  $n$  が  $1$  である場合の 4-(アミドメチル) ピペリジンを特に好ましい例として挙げができる。

上記式 (I) において、 $R^3$  は、水素原子、または（それぞれ同一または異なる任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、もしくは  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基によって置換されていてもよい 1 または 2 個のフェニル基）によって置換されていてもよい  $C_1 \sim C_6$  アルキル基を表す。

$R^3$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 $R^1$ におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、その好適な具体例としては、メチル基、エチル基、およびプロピル基が挙げられる。

5  $R^3$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基は、それぞれ前記 $R^1$ におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

10 なかでも、 $R^3$ は水素原子および無置換の $C_1 \sim C_6$ アルキル基である場合が特に好ましい。

上記式(I)において、 $R^4$ および $R^5$ は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、 $R^4$ および $R^5$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、(任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基)、  
15 フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは $R^4$ および $R^5$ は、いっしょになって3~6員環状炭化水素を形成していてもよい。  
20 フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは $R^4$ および $R^5$ は、いっしょになって3~6員環状炭化水素を形成していてもよい。  
25 フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは $R^4$ および $R^5$ は、いっしょになって3~6員環状炭化水素を形成していてもよい。  
30  $R^4$ および $R^5$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 $R^1$ におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環

の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>におけるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基の置換基としてのハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、およびジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基は、前記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>におけるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基の置換基としてのC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、およびヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基は、前記R<sup>1</sup>において定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>におけるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、およびC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基は、前記R<sup>1</sup>においてフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>およびその隣接炭素原子とからなる「3～6員環状炭化水素」の好適な具体例としては、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペタン、およびシクロヘキサンなどが挙げられる。

なかでも、水素原子とC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基を、R<sup>4</sup>とR<sup>5</sup>の特に好ましい例として挙げができる。

上記式(I)において、pは0または1を表し、qは0または1を表す。pとqがともに0である場合が特に好ましい。

上記式(I)において、Gは、-CO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-O-、-NR<sup>7</sup>-CO-、-CO-NR<sup>7</sup>-、-NH-CO-NH-、-NH-

$-CS-NH-$ 、 $-NR^7-SO_2-$ 、 $-SO_2-NR^7-$ 、 $-NH-CO-O-$ 、または $-O-CO-NH-$ で表される基を表す。ここで、 $R^7$ は、水素原子または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表すか、あるいは $R^7$ は $R^5$ といっしょになって $C_2 \sim C_5$ アルキレン基を形成していくてもよい。

5 ここで、 $-CO-$ はカルボニル基を、 $-SO_2-$ はスルホニル基を、 $-CS-$ はチオカルボニル基をそれぞれ意味する。Gの特に好ましい例としては、例えば $-NR^7-CO-$ および $-NH-CO-NH-$ で表される基などが挙げられる。

10  $R^7$ における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 $R^1$ におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

15  $R^5$ と $R^7$ とからなる「 $C_2 \sim C_5$ アルキレン基」とは、例えば、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、ペンタメチレンなどの $C_2 \sim C_5$ の直鎖または分枝状アルキレン基を意味し、その好適な具体例としてはエチレン、トリメチレン、テトラメチレン基などが挙げられる。

なかでも $R^7$ としては、水素原子を特に好ましい例として挙げることができる。

20 上記式(I)において、 $R^6$ は、フェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基を表し、上記 $R^6$ におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成していくてもよく、さらに上記 $R^6$ におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、  
25 カルボキシリル基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1$

～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N, N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>(アルコキシカルボニル)アミノ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>(アルキルスルホニル)アミノ基、または、ビス(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル)アミノ基により置換されていてもよい。

R<sup>6</sup>におけるC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基および縮合環は、前記R<sup>1</sup>に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>6</sup>における「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基」とは、例えば、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、およびシクロオクテニル基など環状アルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、1-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基などが挙げられる。

なかでもR<sup>6</sup>としては、フェニル基、フリル基、チエニル基、ピラゾリル基、ベンゾチエニル基、インドリル基を特に好ましい例として挙げることができる。

R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としてのハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミ

ノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>、N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、およびジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基は、前記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>6</sup>の置換基としてのC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基は、前記R<sup>1</sup>におけるC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

R<sup>6</sup>の置換基としての「C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルオキシ基」とは、前記C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシリオキシ基などを挙げることができる。

R<sup>6</sup>の置換基としての「N、N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)スルファモイル基」とは、同一または異なった2つの前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基によって置換されたスルファモイル基を意味し、その好適な具体例としては、例えば、N、N-ジメチルスルファモイル基、N、N-ジエチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基などが挙げられる。

R<sup>6</sup>の置換基としての「C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>(アルコキシカルボニル)アミノ基」とは、前記C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、例えば、(メトキシカルボニル)アミノ基、(エトキシカルボニル)アミノ基などを挙げることができる。

R<sup>6</sup>の置換基としての「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>(アルキルスルホニル)アミノ基」とは、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、(メチルスルホニル)アミノ基などを挙げることができる。

R<sup>6</sup>の置換基としての「ビス(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル)アミノ基」とは、同一または異なった2つの前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、

ビス(メチルスルホニル)アミノ基などを挙げることができる。

- なかでも、R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、ハロゲン原子、ニトロ基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、フェニル基、フェニルスルホニル基、アミノ基、ベンジルアミノ基などを好ましい例として挙げができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ニトロ基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、フェニルスルホニル基、およびアミノ基を挙げができる。
- さらに、R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、またはジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。

R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としてのハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、およびジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基は、前記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げができる。

- 上記式(I)で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体は、その治療有効量を製薬学的に許容される担体および／または希釈剤とともに医薬組成物とすることによって、本発明のCCR5の生体内リガンドおよび／またはHIVが標的細胞上のCCR5に結合することを阻害する医薬、あるいはCCR5のリガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する作用をもつ医薬、さらにはCCR5が関与すると考えられる疾患の治療薬も

しくは予防薬とすることができます。

すなわち上記式(I)で表される環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加塩体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体は、経口的に、あるいは、静脈内、皮下、筋肉内、経皮、または直腸内など非経口的に投与することができる。

経口投与の剤形としては、例えば錠剤、丸剤、顆粒剤、散剤、液剤、懸濁剤、カプセル剤などが挙げられる。

錠剤の形態にするには、例えば乳糖、デンプン、結晶セルロースなどの賦形剤；カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリビニルピロリドンなどの結合剤；アルギン酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどの崩壊剤などを用いて通常の方法により成形することができる。

丸剤、散剤、顆粒剤も同様に前記の賦形剤などを用いて通常の方法によって成形することができる。液剤、懸濁剤は、例えばトリカブリリン、トリアセチンなどのグリセリンエステル類、エタノールなどのアルコール類などを用いて通常の方法によって成形される。カプセル剤は、顆粒剤、散剤、あるいは液剤などをゼラチンなどのカプセルに充填することによって成形される。

皮下、筋肉内、静脈内投与の剤型としては、水性あるいは非水性溶液剤などの形態にある注射剤がある。水性溶液剤は、例えば生理食塩水などが用いられる。非水性溶液剤は、例えばプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、オリーブ油、オレイン酸エチルなどが用いられ、これらに必要に応じて防腐剤、安定剤などが添加される。注射剤は、バクテリア保留フィルターを通す濾過、殺菌剤の配合の処置を適宜行うことによって無菌化される。

経皮投与の剤型としては、例えば軟膏剤、クリーム剤などが挙げられ、軟膏剤は、ヒマシ油、オリーブ油などの油脂類、またはワセリンなどを用いて、クリーム剤は、脂肪油、またはジエチレングリコールやソルビタンモノ脂肪酸エステルなどの乳化剤を用いて通常の方法によって成形される。

直腸内投与のためには、ゼラチンソフトカプセルなどの通常の座剤が

用いられる。

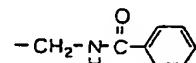
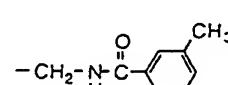
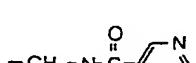
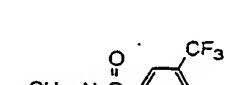
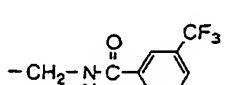
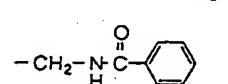
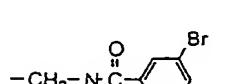
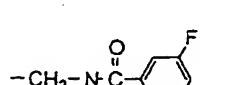
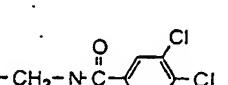
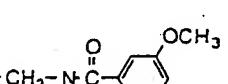
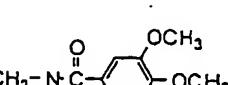
本発明の環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体の投与量は、疾患の種類、投与経路、患者の年齢と性別、および疾患の程度などによって  
5 異なるが、通常成人一人当たり1～500mg／日である。

上記式(I)の環状アミン誘導体の好適な具体例として、下記のTable 1～1.221に示される各置換基を含有する化合物を挙げ  
ることができる。

Table 1～1.221において、「Table」は「表」  
10 を意味し、「Compd. No.」は「化合物番号」を意味し、「chirality」は「絶対配置」を意味する。「chirality  
（絶対配置）」とは、環状アミンの環上の不斉炭素の絶対配置を意味する。「R」は、環状アミンの環上の不斉炭素原子がRの絶対配置をもつこと、「S」は、不斉炭素原子がSの絶対配置をもつこと、「-」はラ  
15 セミ体であるか、あるいは、その化合物が環状アミン上において不斉炭  
素原子をもたないことを意味する。

23

Table 1.1

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{matrix} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{matrix} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
1			1	2	0	-	H	
2			1	2	0	-	H	
3			1	2	0	-	H	
4			1	2	0	-	H	
5			1	2	0	S	H	
6			1	2	0	S	H	
7			1	2	0	S	H	
8			1	2	0	S	H	
9			1	2	0	S	H	
10			1	2	0	S	H	
11			1	2	0	S	H	

## 24

Table 1.2

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \\   \\ R^5 \end{array}$
12	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-OCH_3$
13	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CF_3$
14	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CH_3$
15	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-Cl$
16	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-OCH_3$
17	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-Cl$
18	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CN$
19	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-O$
20	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CF_3$
21	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CF_3$
22	$Cl-C_6H_4-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-CH_2-N(H)C(=O)-C_6H_4-CF_3$

25

Table 1.3

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{C}-(\text{CH}_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
23	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>
24	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(OCC(F)(F)F)cc1</chem>
25	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>
26	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
27	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
28	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	S	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
29	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>
30	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(C(F)(F)C(F)F)cc1</chem>
31	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(Br)cc1</chem>
32	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(F)cc1</chem>
33	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(Cl)cc1</chem>

26

Table 1.4

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (CH_2)_i \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}} (CH_2)_q G - R^6$
34	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(O)cc1</chem>
35	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(O)cc1</chem>
36	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(O)cc1</chem>
37	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>
38	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(C)c1</chem>
39	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)cc1</chem>
40	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(O)cc1</chem>
41	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)cc1</chem>
42	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(C#N)cc1</chem>
43	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc1OC</chem>
44	<chem>Clc1ccc(CC)c1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(C(F)(F)C(F)F)cc1</chem>

## 27

Table 1.5

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
45		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
46		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
47		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
48		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
49		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
50		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
51		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
52		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
53		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
54		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
55		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	

28

Table 1.6

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-(CH_2)_l-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array}(CH_2)_qG-R^6$
56	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
57	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
58	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{Cl})-\text{C}(=\text{O})-$
59	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{Br})-\text{C}(=\text{O})-$
60	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}(=\text{O})-$
61	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
62	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
63	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
64	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{CN})-\text{C}(=\text{O})-$
65	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5)-\text{C}(=\text{O})-$
66	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4\text{H}_5)-\text{C}(=\text{O})-$

29

Table 1.7

Compd. No.	$R_1^1$ $\text{---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} R^4$	$(CH_2)_q G-R^6$
67	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
68	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
69	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
70	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
71	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
72	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
73	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
74	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
75	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
76	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	
77	$\text{Cl---} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{---} \text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+\text{H-C}(=\text{O})-$	

30

Table 1.8

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 > \text{C}-(\text{CH}_2)_l^- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
78		1	2	0	R	H	
79		1	2	0	R	H	
80		1	2	0	R	H	
81		1	2	0	R	H	
82		1	2	0	-	-CH<sub>3</sub>	
83		1	2	0	R	H	
84		1	2	0	R	H	
85		1	2	0	-	H	
86		1	2	0	-	H	
87		1	2	0	S	H	
88		1	2	0	S	H	

31

Table 1.9

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_i$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q G - R^6 \\   \\ R^5 \end{array}$
89		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
90		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
91		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
92		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
93		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
94		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
95		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
96		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
97		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
98		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	
99		$-CH_2-$	1	2	0	S	H	$-(CH_2)_2$	

## 32

Table 1.10

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
100		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
101		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}_2\text{C}$
102		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
103		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{CF}_3$
104		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{CF}_3$
105		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{CF}_3$
106		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$
107		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-\text{CF}_3$
108		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}_2\text{N}$
109		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{NO}_2)-\text{NO}_2$
110		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	S	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^+ \text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NC}_2$

33

Table 1.11

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
111		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2$
112		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FC})_2$
113		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}$
114		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{F}$
115		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Cl}_2$
116		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{OCH}_3$
117		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2$
118		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2$
119		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{CF}_3$
120		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{CH}_3$
121		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Cl}$

3 4

Table 1.12

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\substack{R^4 \\  }}{\underset{R^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
122	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
123	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2$
124	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
125	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})_2$
126	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2$
127	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})\text{CF}_3$
128	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{CF}_3$
129	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2\text{CF}_3$
130	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)_2$
131	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})\text{CF}_3$
132	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O}_2\text{N})_2$

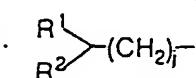
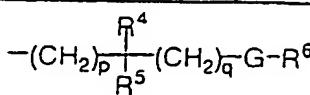
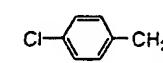
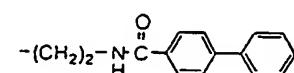
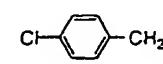
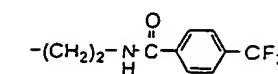
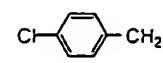
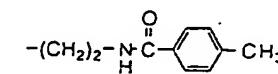
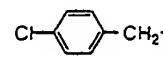
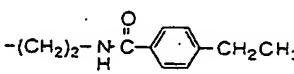
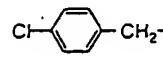
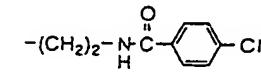
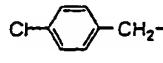
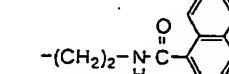
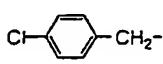
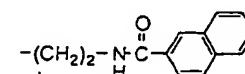
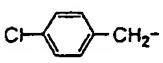
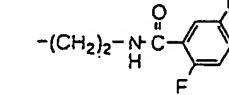
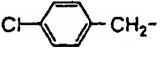
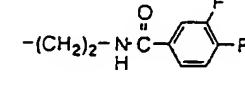
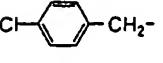
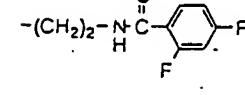
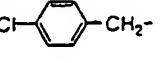
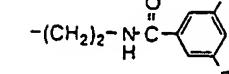
35

Table 1.13

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
133		1	2	0	R	H	
134		1	2	0	R	H	
135		1	2	0	R	H	
136		1	2	0	R	H	
137		1	2	0	R	H	
138		1	2	0	R	H	
139		1	2	0	R	H	
140		1	2	0	R	H	
141		1	2	0	R	H	
142		1	2	0	R	H	
143		1	2	0	R	H	

## 36

Table 1.14

Compd. No.		k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	
144		1	2	0	R	H	
145		1	2	0	R	H	
146		1	2	0	R	H	
147		1	2	0	R	H	
148		1	2	0	R	H	
149		1	2	0	R	H	
150		1	2	0	R	H	
151		1	2	0	R	H	
152		1	2	0	R	H	
153		1	2	0	R	H	
154		1	2	0	R	H	

37

Table 1.15

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \\ \diagup \\ -\text{CH}_2-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\substack{R^4 \\   \\ R^5}}{\underset{\substack{  \\ \text{O} \\  }}{\text{N}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
155		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OC}_2\text{H}_5)-\text{OC}_2\text{H}_5$
156		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)-\text{OCF}_3$
157		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
158		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3-\text{CO}_2\text{CH}_3$
159		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
160		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
161		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
162		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
163		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
164		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{FCOCF}_3)-\text{FCOCF}_3$
165		1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\overset{\substack{\text{H} \\  }}{\text{N}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$

Table 1.16

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	k	m	n	chirality	$\text{R}^4$	$\text{R}^5$	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{G-R}^6$
166		H	1	2	0	R			
167		H	1	2	0	R			
168		H	1	2	0	R			
169		H	1	2	0	R			
170		H	1	2	0	R			
171		H	1	2	0	R			
172		H	1	2	0	R			
173		H	1	2	0	R			
174		H	1	2	0	R			
175		H	1	2	0	R			
176		H	1	2	0	R			

39

Table 1.17

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
177		1	2	0	R	H	
178		1	2	0	R	H	
179		1	2	0	R	H	
180		1	2	0	R	H	
181		1	2	0	R	H	
182		1	2	0	R	H	
183		1	2	0	R	H	
184		1	2	0	R	H	
185		1	2	0	R	H	
186		1	2	0	R	H	
187		1	2	0	R	H	

40

Table 1.18

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} > (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R <sup>j</sup>	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
188		1	2	0	R	H	
189		1	2	0	R	H	
190		1	2	0	R	H	
191		1	2	0	R	H	
192		1	2	0	R	H	
193		1	2	0	R	H	
194		1	2	0	R	H	
195		1	2	0	R	H	
196		1	2	0	R	H	
197		1	2	0	R	H	
198		1	2	0	R	H	

41

Table 1.19

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \\ \diagup \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G}-R^6$
199		1	2	0	R	H	
200		1	2	0	R	H	
201		1	2	0	R	H	
202		1	2	0	R	H	
203		1	2	0	R	H	
204		1	2	0	R	H	
205		1	2	0	R	H	
206		1	2	0	R	H	
207		1	2	0	R	H	
208		1	2	0	R	H	
209		1	2	0	R	H	

42

Table 1.20

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \searrow - (CH_2)_l - \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \overset{\underset{(S)}{ }}{\underset{(R)}{ }} \begin{array}{c} R^4 \\   \\ (CH_2)_q G - R^6 \end{array}$
210	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
211	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
212	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
213	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
214	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
215	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
216	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
217	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
218	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
219	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	
220	<chem>Clc1ccccc1-CH2-</chem>	1	2	0	-	H	

## 4 3

Table 1.21

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{C}-(\text{CH}_2)_i-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-\text{C}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6\end{array}$
221		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
222		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{Cl}$
223		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\alpha(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
224		1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{S}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_3$
225		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_5$
226		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
227		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
228		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
229		1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}(\text{CH}_2)-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
230		1	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
231		1	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_3$

## 44

Table 1.2.2

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$\text{R}^4$ $(\text{CH}_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
232		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
233		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
234		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
235		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
236		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
237		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
238		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	-	H			
239		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	S	H			
240		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	S	H			
241		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	S	H			
242		$(\text{CH}_2)_l$	1	2	0	S	H			

45

Table 1.23

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2\text{---}(CH_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{ }}(CH_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
243		1	2	0	S	H	
244		1	2	0	S	H	
245		1	2	0	S	H	
246		1	2	0	S	H	
247		1	2	0	S	H	
248		1	2	0	S	H	
249		1	2	0	S	H	
250		1	2	0	S	H	
251		1	2	0	S	H	
252		1	2	0	S	H	
253		1	2	0	S	H	

46

Table 1.24

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
254		1	2	0	S	H	
255		1	2	0	S	H	
256		1	2	0	S	H	
257		1	2	0	S	H	
258		1	2	0	S	H	
259		1	2	0	S	H	
260		1	2	0	S	H	
261		1	2	0	S	H	
262		1	2	0	S	H	
263		1	2	0	S	H	
264		1	2	0	S	H	

47

Table 1.25

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	k	m	n	chirality	$\text{R}^4$	$\text{R}^5$	$-(\text{CH}_2)_p(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
265		H	1	2	0	S			
266		H	1	2	0	S			
267		H	1	2	0	S			
268		H	1	2	0	S			
269		H	1	2	0	S			
270		H	1	2	0	S			
271		H	1	2	0	S			
272		H	1	2	0	S			
273		H	1	2	0	S			
274		H	1	2	0	S			
275		H	1	2	0	S			

Table 1.26

Compd. No.	$R_1^1$ $R_2^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
276		1	2	0	S	H	
277		1	2	0	S	H	
278	$\text{H}_3\text{CO}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	
279	$\text{F}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	
280		1	2	0	S	H	
281	$\text{HO}_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	
282	$(\text{H}_3\text{C})_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	S	H	
283		1	2	0	S	H	
284		1	2	0	S	H	
285		1	2	0	R	H	
286		1	2	0	R	H	

49

Table 1.27

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}- \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
287			1	2	0	R	H	
288			1	2	0	R	H	
289			1	2	0	R	H	
290			1	2	0	R	H	
291			1	2	0	R	H	
292			1	2	0	R	H	
293			1	2	0	R	H	
294			1	2	0	R	H	
295			1	2	0	R	H	
296			1	2	0	R	H	
297			1	2	0	R	H	

50

Table 1.2.8

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} > -(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q G-R^6$
298		1	2	0	R	H	
299		1	2	0	R	H	
300		1	2	0	R	H	
301		1	2	0	R	H	
302		1	2	0	R	H	
303		1	2	0	R	H	
304		1	2	0	R	H	
305		1	2	0	R	H	
306		1	2	0	R	H	
307		1	2	0	R	H	
308		1	2	0	R	H	

## 51

Table 1.29

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$\text{k}$	$\text{m}$	$\text{n}$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \text{C}(\text{R}^4) \text{R}^5 (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
309		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
310		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
311		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
312		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
313		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
314		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
315		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
316		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
317		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
318		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
319		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	

## 52

Table 1.30

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
320		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
321		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
322		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
323		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
324		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
325		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
326		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
327		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
328		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
329		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
330		$(\text{CH}_2)_3$	0	3	1	-	H	

53

Table 1.3.1

Compd. No.	$\text{R}_1^1$ $\text{R}_2^1$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}_5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
331		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
332		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3-\text{OCH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
333		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN})-\text{C}(=\text{O})-$
334		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
335		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2)-\text{C}(=\text{O})-$
336		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
337		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
338		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
339		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
340		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	S	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3)-\text{C}(=\text{O})-$
341		$\text{CH}_2^-$	0	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}_6\text{H}_4)-\text{C}(=\text{O})-$

## 5 4

Table 1.3.2

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{I}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
342		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
343		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
344		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
345		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
346		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
347		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
348		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
349		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
350		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
351		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	
352		$(\text{CH}_2)_l^-$	0	3	1	-	H	

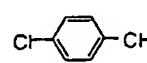
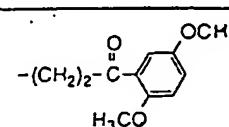
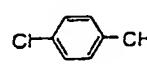
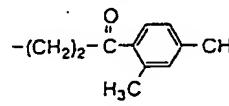
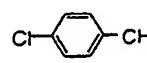
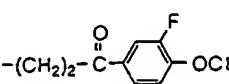
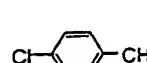
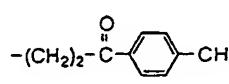
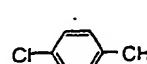
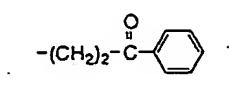
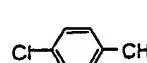
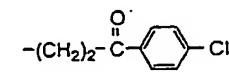
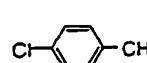
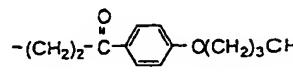
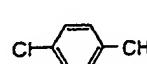
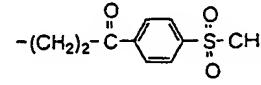
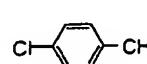
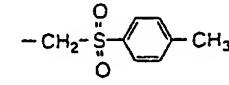
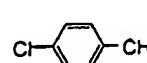
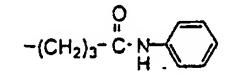
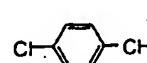
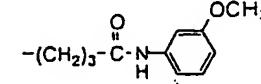
55

Table 1.33

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-C(=O)- \\   \\ CH_2-q-G-R^6 \end{array}$
353		1	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
354		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
355		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$
356		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{N}$
357		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$
358		1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
359		1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
360		1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}^{\text{H}}\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{NO}_2$
361		1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
362		1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$
363		1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4\text{S}$

5 6

Table 1.3.4

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_p -$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
364		1	3	0	-	H	
365		1	3	0	-	H	
366		1	3	0	-	H	
367		1	3	0	-	H	
368		1	3	0	-	H	
369		1	3	0	-	H	
370		1	3	0	-	H	
371		1	3	0	-	H	
372		1	3	0	-	H	
373		1	3	0	-	H	
374		1	3	0	-	H	

57

Table 1.35

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $(\text{CH}_2)_q$ $\text{G-R}^6$
375		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
376		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
377		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}(\text{CH}_2)-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
378		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}$
379		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{CH}_3$
380		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\overset{\text{O}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$
381		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
382		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{O}}{\text{C}}}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$
383		$(\text{CH}_2)_3$	1	3	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}}-\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
384		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{CH}_3}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
385		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{NO}_2}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$

Table 1.3.6

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^4$	$\text{R}^5$	$\text{R}^6$		
	$\text{--}(\text{CH}_2)_j\text{--}$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{G--R}^6$
386		2	2	0	-	H	
387		2	2	0	-	H	
388		2	2	0	-	H	
389		2	2	0	-	H	
390		2	2	0	-	H	
391		2	2	0	-	H	
392		2	2	0	-	H	
393		2	2	0	-	H	
394		2	2	0	-	H	
395		2	2	0	-	H	
396		2	2	0	-	H	

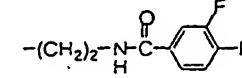
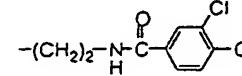
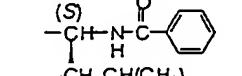
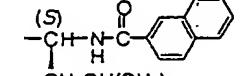
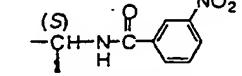
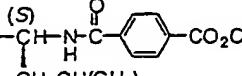
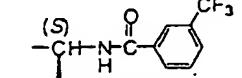
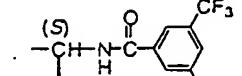
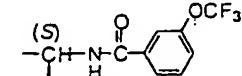
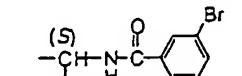
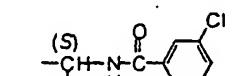
59

Table 1.37

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
397		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2$
398		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
399		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{H})_2$
400		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4(\text{NO}_2)$
401		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4(\text{CO}_2\text{CH}_3)$
402		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2$
403		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2\text{F}$
404		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)_2$
405		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}$
406		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2$
407		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3\text{Br}$

60

Table 1.38

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
408		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
409		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
410		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
411		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
412		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
413		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
414		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
415		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
416		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
417		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	
418		$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	

61

Table 1.3.9

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \\   \\ R^5 \end{array}$ G-R <sup>6</sup>
419.		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
420		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
421		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
422		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
423		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
424		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
425		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
426		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
427		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
428		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	
429		$(CH_2)_2$	2	2	0	-	H	

62

Table 1.40

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-\text{C}-\end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
430		2	2	0	-	H	
431		2	2	0	-	H	
432		2	2	0	-	H	
433		2	2	0	-	H	
434		1	3	1	-	H	
435		1	3	1	-	H	
436		1	3	1	-	H	
437		1	3	1	-	H	
438		1	3	1	-	H	
439		1	3	1	-	H	
440		1	3	1	-	H	

## 63

Table 1.41

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ C-H \\   \\ R^2 \end{array}-(CH_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ C-H \\   \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
441	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Br)cc1</chem>
442	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)cc1</chem>
443	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Br)cc1</chem>
444	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(F)cc1</chem>
445	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(Cl)c(Cl)c1</chem>
446	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C</chem>
447	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc2ccccc2c1</chem>
448	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
449	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc(C(=O)OC(=O)c2ccccc2)cc1</chem>
450	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>
451	<chem>Clc1ccc(CC)c(C)c1</chem>	1	3	1	-	H	<chem>-(CH2)2-NHC(=O)c1ccc(C(F)(F)F)cc1</chem>

## 64

Table 1.42

Compd. No.	$\begin{array}{c} \text{R}^1 \\   \\ \text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C}-\text{CH}_2-\end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
452	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$
453	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
454	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
455	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
456	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{F}_4$
457	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	1	3	1	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{Cl}_2$
458	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
459	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
460	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
461	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
462	<chem>CC(c1ccccc1)C-</chem>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$

65

Table 1.43

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_i$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \text{C}(=\text{O}) \text{R}^4$ $\text{R}^5$	$-(\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
463		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
464		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
465		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
466		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
467		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
468		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
469		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
470		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
471		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
472		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		
473		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		

6 6

Table 1.44

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
474		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
475		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
476		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2$
477		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$
478		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_5\text{N}$
479		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}$
480		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{OBr}$
481		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{S}$
482		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
483		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3$
484		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_1\text{H}_5\text{N}$

67

Table 1.45

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
485	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-$
486	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
487	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
488	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2$
489	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
490	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OC}_2\text{H}_5$
491	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-$
492	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCF}_3$
493	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-$
494	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{F}$
495	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^+ \text{H}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-$

68

Table 1.46

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
496		2	2	1	-	H	
497		2	2	1	-	H	
498		2	2	1	-	H	
499		2	2	1	-	H	
500		2	2	1	-	H	
501		2	2	1	-	H	
502		2	2	1	-	H	
503		2	2	1	-	H	
504		2	2	1	-	H	
505		2	2	1	-	H	
506		2	2	1	-	H	

6 9

Table 1.47

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---G---R}^6$
507	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{H}_3\text{C} \\    \\ \text{O} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
508	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{S} \\    \\ \text{O} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
509	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{Br} \\    \\ \text{S} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
510	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\    \\ \text{O} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_3$
511	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
512	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\    \\ \text{CN} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
513	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---}\begin{array}{c} \text{C---CH}_3 \\    \\ \text{O} \end{array}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}$
514	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---C}(\text{CH}_3)_3$
515	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{OH}$
516	$\text{H}_2\text{N---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$
517	$\text{H}_2\text{N---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---N}^{\text{H}}\text{---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CF}_3$

70

Table 1.48

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \text{R}^4 - (\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
518		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	
519		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	
520		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	$-\text{CH}_3$	
521		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-$	
522		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	$-\text{CH}_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-$	
523		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-$	
524		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	$-\text{CH}_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-$	
525		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	
526		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	
527		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	
528		$(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H	

71

Table 1.49

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_i$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
529		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
530		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
531		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
532		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
533		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
534		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
535		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
536		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
537		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
538		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
539		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	

72

Table 1.50

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
540		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
541		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
542		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
543		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
544		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
545		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
546		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
547		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
548		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
549		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
550		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	

73

Table 1.5.1

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ $\text{---}(\text{CH}_2)_k\text{---}$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{---G---R}^6$
551		2	2	1	-	H	
552		2	2	1	-	H	
553		2	2	1	-	H	
554		2	2	1	-	H	
555		2	2	1	-	H	
556		2	2	1	-	H	
557		2	2	1	-	H	
558		2	2	1	-	H	
559		2	2	1	-	H	
560		2	2	1	-	H	
561		2	2	1	-	H	

74

Table 1.52

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{H} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
562	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{Cl}$
563	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
564	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_5$
565	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
566	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{OCF}_3$
567	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{Cl}$
568	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3$
569	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{F}$
570	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{F}$
571	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
572	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{NHCF}_3$

75

Table 1.53

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
573	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
574	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
575	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
576	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
577	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
578	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
579	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
580	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
581	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
582	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
583	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

76

Table 1.5.4

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{H} \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
584		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
585		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
586		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
587		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
588		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
589		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
590		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
591		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
592		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
593		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
594		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	

77

Table 1.55

Compd. No.	$\text{R}_1^1$ $\text{R}_2^1$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{CH}-\text{N}^+ \\   \\ \text{H} \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
595		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
596		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
597		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
598		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
599		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
600		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
601		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
602		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
603		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
604		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
605		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	

78

Table 1.56

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$	$\text{R}^4$	$(\text{CH}_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
								$\text{R}^5$			
606		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
607		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	:	H				
608		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
609		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
610		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
611		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
612		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
613		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
614		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
615		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
616		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				

79

Table 1.57

Compd. No.	$\text{R}_1$ $\text{R}_2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}_5$	$\text{R}^4$	$-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
617	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
618	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
619	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CN}$
620	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
621	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
622	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{CH}_3)_2$
623	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3$
624	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2$
625	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2$
626	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{F}_5$
627	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{CH}_2$	2	2	1	-	H	$\text{CH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{O}$ $\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$

80

Table 1.5.8

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \text{C}(=\text{O}) \text{R}^4$ $\text{R}^5$ $(\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
628		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
629		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
630		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
631		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
632		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
633		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
634		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
635		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
636		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
637		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
638		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

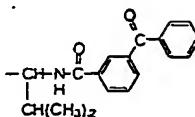
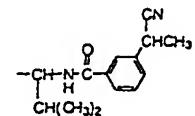
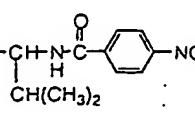
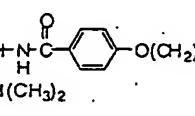
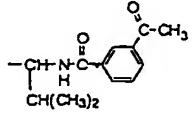
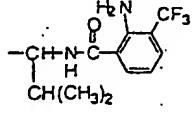
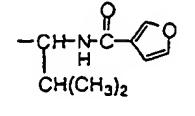
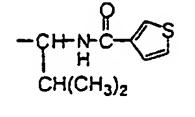
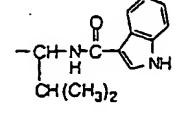
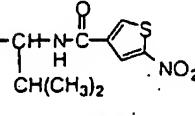
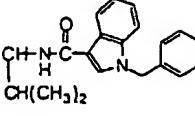
81

Table 1.59

Compd. No.	$\text{R}_1^{\text{l}}$ $\text{R}_2^{\text{l}}$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^{\text{r}} \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{H} \end{array} (\text{CH}_2)_q^{\text{s}} \text{G}-\text{R}^6$
639		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$
640		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_3 \end{array}$
641		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{CO}_2\text{CH}_3 \end{array}$
642		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$
643		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3 \end{array}$
644		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
645		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2 \end{array}$
646		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2\text{OH} \end{array}$
647		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3 \end{array}$
648		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$
649		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{C}-\text{N} \begin{array}{c} \text{H} \\   \\ \text{C}-\text{H} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$

82

Table 1.60

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
650	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
651	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
652	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
653	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
654	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
655	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
656	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
657	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
658	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
659	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
660	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

83

Table 1.6.1

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$	$(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$
661		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
662		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
663		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
664		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
665		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
666		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
667		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
668		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
669		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
670		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	
671		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H		$(\text{CH}_2)_2$	

84

Table 1.6.2

Compd. No.	$\text{R}_1$ $\text{R}_2$ $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(\text{CH}_2)_q\text{G---R}^6$
672		2	2	1	-	H	
673		2	2	1	-	H	
674		2	2	1	-	H	
675		2	2	1	-	H	
676		2	2	1	-	H	
677		2	2	1	-	H	
678		2	2	1	-	H	
679		2	2	1	-	H	
680		2	2	1	-	H	
681		2	2	1	-	H	
682		2	2	1	-	H	

85

Table 1.63

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{matrix} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{matrix} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
683			2	2	1	-	H	
684			2	2	1	-	H	
685			2	2	1	-	H	
686			2	2	1	-	H	
687			2	2	1	-	H	
688			2	2	1	-	H	
689			2	2	1	-	H	
690			2	2	1	-	H	
691			2	2	1	-	H	
692			2	2	1	-	H	
693			2	2	1	-	H	

86

Table 1.6.4

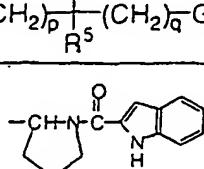
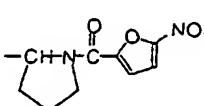
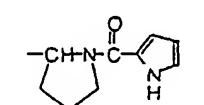
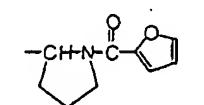
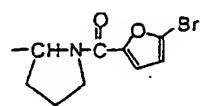
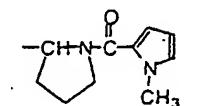
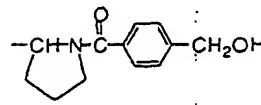
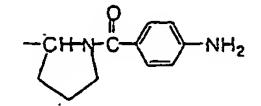
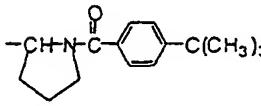
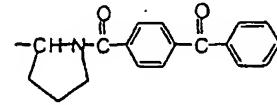
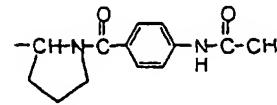
Compd. No.	$R_1^1$ $\text{---} \text{---} \text{---} \text{---}$ $R_2^2$	$(\text{CH}_2)_l^3$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p^4$ $\text{---} \text{---} \text{---} \text{---}$ $R_5^5$	$(\text{CH}_2)_q^6$ G-R <sup>6</sup>
694		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
695		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
696		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
697		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
698		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
699		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
700		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
701		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
702		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
703		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		
704		$(\text{CH}_2)_l^3$	2	2	1	-	H		

87

Table 1.65

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $-(\text{CH}_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
705		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
706		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
707		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
708		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
709		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
710		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
711		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
712		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
713		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
714		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		
715		- $(\text{CH}_2)_2-$	2	2	1	-	H		

Table 1.66

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
716	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
717	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
718	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
719	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
720	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
721	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
722	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
723	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
724	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
725	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
726	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

89

Table 1.67

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^4$	$\text{R}^5$	$\text{R}^6$
	$\text{--}(\text{CH}_2)_l\text{--}$	$\text{k}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	$\text{G--R}^6$
		$\text{m}$		$\text{n}$	
727	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
728	$\text{Cl--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
729	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
730	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
731	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
732	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
733	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
734	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
735	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
736	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-
737	$\text{CH--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-

90

Table 1.68

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{matrix} \text{R}^4 \\   \\ \text{C}=\text{O} \end{matrix} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
738		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
739		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
740		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
741		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
742		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
743		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
744		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
745		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
746		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
747		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
748		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	

91

Table 1.6.9

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ $\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{H} \end{array}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---G---R}^6$
749	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
750	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
751	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
752	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
753	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
754	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
755	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
756	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
757	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
758	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
759	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	

92

Table 1.70

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$ - $(\text{CH}_2)_q$ -G-R <sup>6</sup>
760		2	2	1	-	H	
761		2	2	1	-	H	
762		2	2	1	-	H	
763		2	2	1	-	H	
764		2	2	1	-	H	
765		2	2	1	-	H	
766		2	2	1	-	H	
767		2	2	1	-	H	
768		2	2	1	-	H	
769		2	2	1	-	H	
770		2	2	1	-	H	

93

Table 1.71

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q\text{G-R}^6$
771		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
772		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
773		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
774		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
775		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
776		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
777		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
778		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
779		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
780		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
781		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	

94

Table 1.72

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} R^2 \\   \\ -CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
782	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
783	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
784	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
785	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
786	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
787	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
788	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
789	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
790	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
791	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	
792	$-CH_2-$	2	2	1	-	H	

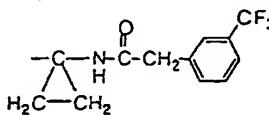
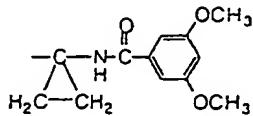
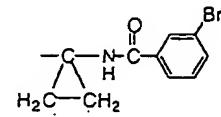
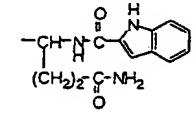
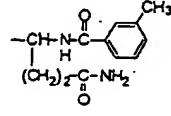
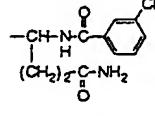
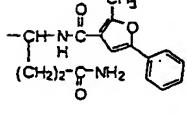
95

Table 1.73

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$\text{R}^4$	$(\text{CH}_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
793	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
794	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
795	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
796	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
797	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
798	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
799	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
800	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
801	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
802	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				
803	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H				

96

Table 1.74

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}-\text{N}(\text{H})-\text{C}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^6 \\   \\ \text{H}_2\text{C}-\text{CH}_2 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
804	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
805	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
806	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
807	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
808	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
809	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
810	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
811	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
812	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
813	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
814	<chem>Clc1ccccc1</chem>	$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	

97

Table 1.75

Compd. No.	$R_1$ $\text{R}_2\text{---}(\text{CH}_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
815		2	2	1	-	H	
816		2	2	1	-	H	
817		2	2	1	-	H	
818		2	2	1	-	H	
819		2	2	1	-	H	
820		2	2	1	-	H	
821		2	2	1	-	H	
822		2	2	1	-	H	
823		2	2	1	-	H	
824		2	2	1	-	H	
825		2	2	1	-	H	

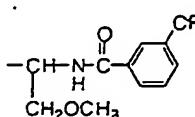
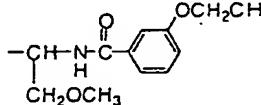
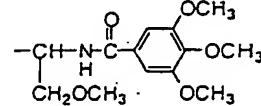
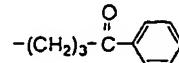
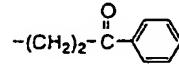
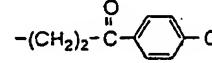
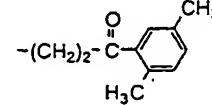
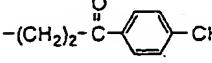
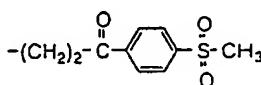
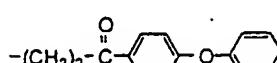
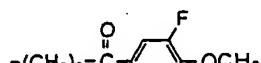
98

Table 1.76

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	( $\text{CH}_2$ ) <sub>i</sub> -	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
826			2	2	1	-	H	
827			2	2	1	-	H	
828			2	2	1	-	H	
829			2	2	1	-	H	
830			2	2	1	-	H	
831			2	2	1	-	H	
832			2	2	1	-	H	
833			2	2	1	-	H	
834			2	2	1	-	H	
835			2	2	1	-	H	
836			2	2	1	-	H	

99

Table 1.77

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-(CH_2)_l-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
837	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
838	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
839	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
840	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
841	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
842	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
843	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
844	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
845	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
846	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	
847	<chem>Clc1ccc(cc1)CH2-</chem>	2	2	1	-	H	

100

Table 1.78

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$	$\text{R}^4$	$(\text{CH}_2)_q$	$\text{G-R}^6$
								$\text{R}^5$			
848		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
849		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
850		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
851		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
852		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
853		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
854		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
855		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
856		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
857		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				
858		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H				

101

Table 1.79

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \searrow \swarrow \\ \diagdown \quad \diagup \\ -\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
859		2	2	1	-	H	
860		2	2	1	-	H	
861		2	2	1	-	H	
862		2	2	1	-	H	
863		2	2	1	-	H	
864		2	2	1	-	H	
865		2	2	1	-	H	
866		2	2	1	-	H	
867		2	2	1	-	H	
868		2	2	1	-	H	
869		2	2	1	-	H	

102

Table 1.80

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{matrix} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}_5 \end{matrix} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
870			2	2	1	-	H	
871			2	2	1	-	H	
872			2	2	1	-	H	
873			2	2	1	-	H	
874			2	2	1	-	H	
875			2	2	1	-	H	
876			2	2	1	-	H	
877			2	2	1	-	H	
878			2	2	1	-	H	
879			2	2	1	-	H	
880			2	2	1	-	H	

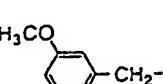
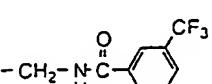
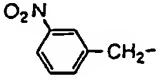
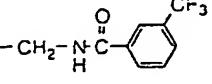
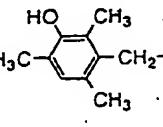
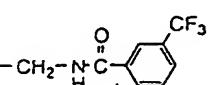
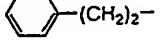
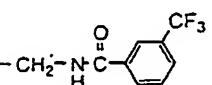
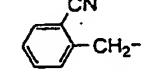
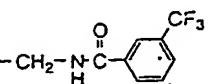
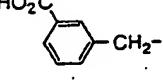
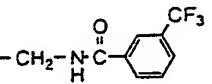
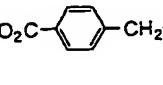
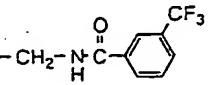
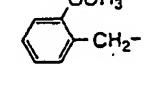
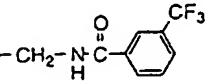
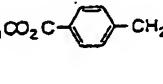
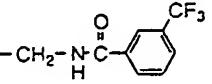
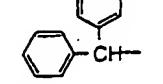
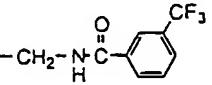
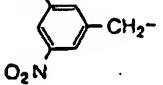
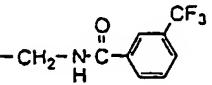
103

Table 1.8.1

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3 \\   \\ \text{H} \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
881			2	2	1	-	H	
882			2	2	1	-	H	
883			2	2	1	-	H	
884			2	2	1	-	H	
885			2	2	1	-	H	
886			2	2	1	-	H	
887			2	2	1	-	H	
888			2	2	1	-	H	
889			2	2	1	-	H	
890			2	2	1	-	H	
891			2	2	1	-	H	

104

Table 1.82

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$\geq (CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\overset{R^4}{ }$ $\overset{R^5}{ }$ $(CH_2)_q-G-R^6$
892			2	2	1	-	H	
893			2	2	1	-	H	
894			2	2	1	-	H	
895			2	2	1	-	H	
896			2	2	1	-	H	
897			2	2	1	-	H	
898			2	2	1	-	H	
899			2	2	1	-	H	
900			2	2	1	-	H	
901			2	2	1	-	H	
902			2	2	1	-	H	

105

Table 1.8.3

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{I}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
903			2	2	1	-	H	
904			2	2	1	-	H	
905			2	2	1	-	H	
906			2	2	1	-	H	
907			2	2	1	-	H	
908			2	2	1	-	H	
909			2	2	1	-	H	
910			2	2	1	-	H	
911			2	2	1	-	H	
912			2	2	1	-	H	
913			2	2	1	-	H	

106

Table 1.84

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p-$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \end{array}$
914			2	2	1	-	H	
915			2	2	1	-	H	
916			2	2	1	-	H	
917			2	2	1	-	H	
918	$H_3CO_2C-$		2	2	1	-	H	
919	$H_3C-$		2	2	1	-	H	
920			2	2	1	-	H	
921			2	2	1	-	H	
922			2	2	1	-	H	
923			2	2	1	-	H	
924			2	2	1	-	H	

107

Table 1.85

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
925		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
926		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
927		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
928		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
929		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
930		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
931		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
932		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
933		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
934		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	
935		$(\text{CH}_2)_l^-$	2	2	1	-	H	

108

Table 1.86

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{I}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
936			2	2	1	-	H	
937			2	2	1	-	H	
938			2	2	1	-	H	
939			2	2	1	-	H	
940			2	2	1	-	H	
941			2	2	1	-	H	
942			2	2	1	-	H	
943			1	4	0	-	H	
944			1	4	0	-	H	
945			1	4	0	-	H	
946			1	4	0	-	H	

109

Table 1.87

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
947		$(\text{CH}_2)_4^-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)_2$
948		$(\text{CH}_2)_4^-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2$
949		$(\text{CH}_2)_4^-$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$
950		$(\text{CH}_2)_4^-$	0	4	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
951		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O}-\text{C}-\text{CH}_3)_2$
952		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{N}(\text{CH}_3)_2)_2$
953		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{N}(\text{CH}_3)_2)_2$
954		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{H}_3\text{C}-\text{NH})_2$
955		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{H}_3\text{C}-\text{NH})_2$
956		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{HO})_2$
957		$(\text{CH}_2)_2^-$	1	2	0	R	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2$

110

Table 1.88

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
958		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
959		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
960		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
961		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
962		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
963		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
964		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
965		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
966		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
967		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	
968		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	

1 1 1

Table 1.89

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 > (CH_2)_l \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
969	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
970	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
971	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
972	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
973	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
974	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
975	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
976	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
977	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
978	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>
979	<chem>Clc1ccc(CC)cc1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-(CH2)2NHC(=O)c1ccc[nH]1</chem>

1 1 2

Table 1.90

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ R^4 \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
980		1	2	0	R	H	
981		1	2	0	R	H	
982		1	2	0	R	H	
983		1	2	0	R	H	
984		1	2	0	R	H	
985		1	2	0	R	H	
986		1	2	0	R	H	
987		2	2	1	-	H	
988		1	4	0	-	H	
989		1	4	0	-	H	
990		1	4	0	-	H	

113

Table 1.9.1

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$
991	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-$	<chem>O=Cc1ccccc1</chem>
992	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-$	<chem>O=Cc1ccc(Oc2ccc(O)cc2)cc1</chem>
993	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_2-\text{C}(=\text{O})-$	<chem>O=Cc1ccc(C)c(c1)C</chem>
994	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_5-\text{C}(=\text{O})-$	<chem>O=Cc1ccccc1</chem>
995	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-$	<chem>O=Cc1ccc(Oc2ccc(O)cc2)cc1</chem>
996	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_4$	1	4	0	-	H	$-(\text{CH}_2)_3-\text{C}(=\text{O})-\text{N}$	<chem>CN1C=CC=C1</chem>
997	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}$	<chem>CC(C)CCN(C(=O)c1ccccc1)C</chem>
998	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}$	<chem>CC(C)CCN(C(=O)c1ccccc1)C(F)(F)</chem>
999	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}$	<chem>CC(C)CCN(C(=O)c1ccccc1)C(CH3)2</chem>
1000	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}$	<chem>CC(C)CCN(C(=O)c1ccc(Oc2ccc(O)cc2)cc1)C</chem>
1001	<chem>Clc1ccc(cc1)C-</chem>	$\text{C}(\text{H}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}$	<chem>CC(C)CCN(C(=O)c1ccc(OCC)cc1)C</chem>

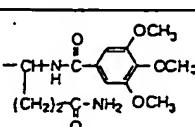
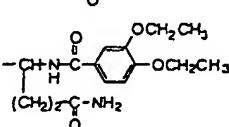
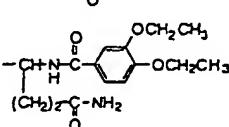
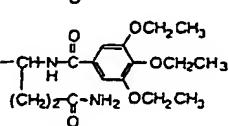
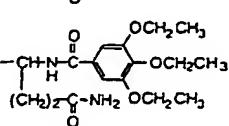
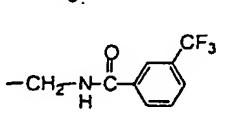
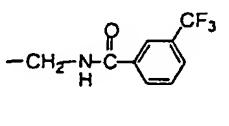
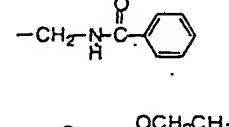
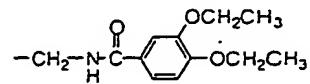
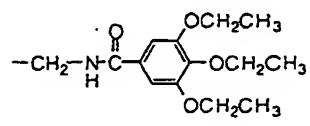
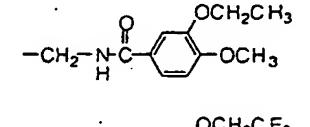
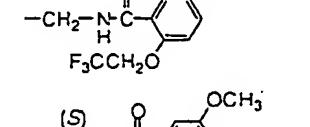
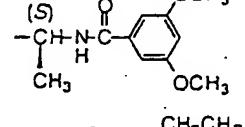
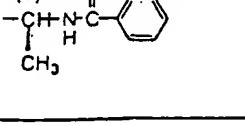
114

Table 1.92

Compd. No.	$R_1$ $\text{R}_2\text{---}(CH_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(CH_2)_q\text{---G---R}^6$
1002	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCF}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1003	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{CH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1004	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1005	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1006	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_2\text{CH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1007	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_2\text{CH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1008	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---(CH}_2)_2\overset{\text{O}}{\underset{\text{NH}_2}{\text{C}}}\text{---NH}_2$
1009	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---(CH}_2)_2\overset{\text{O}}{\underset{\text{NH}_2}{\text{C}}}\text{---NH}_2$
1010	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---(CH}_2)_2\overset{\text{O}}{\underset{\text{NH}_2}{\text{C}}}\text{---NH}_2$
1011	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{CH}_3$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
1012	$\text{Cl---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}(\text{H})\text{---N---C}(=\text{O})\text{---C}_6\text{H}_4\text{---(CH}_2)_2\overset{\text{O}}{\underset{\text{NH}_2}{\text{C}}}\text{---NH}_2$ $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$

115

Table 1.93

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	( $\text{CH}_2$ ) <sub>k</sub>	$\text{k}$	$\text{m}$	$\text{n}$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \text{C}(=\text{O}) \text{R}^4$ $\text{R}^5$	$-(\text{CH}_2)_q \text{G}-\text{R}^6$
1013	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1014	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1015	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1016	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H		
1017	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H		
1018	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1019	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1020	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1021	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1022	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		
1023	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H		

116

Table 1.9.4

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{CH}+\text{N}(\text{H})-\text{C}- \\   \\ \text{CH}_3 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
1024		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1025		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1026		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1027		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1028		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1029		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1030		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1031		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1032		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1033		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
1034		$\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	

117

Table 1.95

Compd. No.	$R^1$ $\text{---}R^2\text{---}(CH_2)_k\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\overset{R^4}{ }}{R^5}\text{---}(CH_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1035	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_2\text{CH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1036	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_2\text{CH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---}\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1037	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_2\text{CH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_3$
1038	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_2\text{CF}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4\text{---OCH}_2\text{CF}_3$
1039	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_2\text{CH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1040	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCF}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1041	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$(R)\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{CH}_3}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1042	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{Br}}{ }}{\underset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1043	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{Cl}}{ }}{\underset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1044	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{CH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$
1045	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}CH_2\text{---}$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{---}\overset{\overset{\text{OCH}_3}{ }}{\underset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{CH}}\text{---N---C---}}{\text{O}}}\text{---C}_6\text{H}_4$

118

Table 1.9.6

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$\text{R}^4$	$-(\text{CH}_2)_q$ $\text{G}-\text{R}^6$
1046		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1047		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1048		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1049		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1050		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1051		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1052		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1053		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1054		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1055		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			
1056		$(\text{CH}_2)_l$	2	2	1	-	H			

119

Table 1.9.7

Compd. No.	$R_1^1$ $\text{---} \begin{array}{c} \text{---} \\   \\ \text{C---} \end{array} \text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \text{---} \\   \\ \text{C---} \end{array} \text{---} (CH_2)_q G-R^6$
1057		2	2	1	-	H	
1058		2	2	1	-	H	
1059		2	2	1	-	H	
1060		2	2	1	-	H	
1061		2	2	1	-	H	
1062		2	2	1	-	H	
1063		2	2	1	-	H	
1064		2	2	1	-	H	
1065		2	2	1	-	H	
1066		2	2	1	-	H	
1067		2	2	1	-	H	

120

Table 1.98

Compd. No.	$R^1$ $\text{---} \begin{array}{c} \text{R}^2 \\   \\ (\text{CH}_2)_j \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{---} \begin{array}{c} \text{R}^5 \\   \\ \text{G} \end{array} \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G} \text{---} R^6$
1068		2	2	1	-	H	
1069		2	2	1	-	H	
1070		2	2	1	-	H	
1071		2	2	1	-	H	
1072		2	2	1	-	H	
1073		2	2	1	-	H	
1074		2	2	1	-	H	
1075		2	2	1	-	H	
1076		2	2	1	-	H	
1077		2	2	1	-	H	
1078		2	2	1	-	H	

1 2 1

Table 1.9.9

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	( $\text{CH}_2$ ) <sub>j</sub>	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^4$ $\text{R}^5$
1079		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1080		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1081		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1082		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1083		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1084		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1085		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1086		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1087		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1088		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	
1089		$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	

122

Table 1.100

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}$ $(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1090	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3)$
1091	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl})$
1092	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2)$
1093	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NH}_2)$
1094	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}$
1095	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O})$
1096	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F})$
1097	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3)$
1098	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_3-\text{Br})$
1099	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}-\text{Br})$
1100	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{H}}(\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{F}-\text{Cl})$

1 2 3

Table 1.101

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k$	$k$	$m$	$n$	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1101		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1102		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1103		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1104		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1105		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1106		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1107		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1108		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1109		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1110		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1111		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	

1 2 4

Table 1.102

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$ $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1112		1	2	0	R	H	
1113		2	2	1	-	H	
1114		2	2	1	-	H	
1115		2	2	1	-	H	
1116		2	2	1	-	H	
1117		2	2	1	-	H	
1118		1	2	0	R	H	
1119		1	2	0	R	H	
1120		1	2	0	R	H	
1121		1	2	0	R	H	
1122		1	2	0	R	H	

1 2 5

Table 1.103

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$R^4$ $R^5$	$-(CH_2)_p-(CH_2)_q-G-R^6$
1123		$(CH_2)_2-$	1	2	0	R	H		
1124		$(CH_2)_2-$	1	2	0	R	H		
1125		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1126		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1127		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1128		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1129		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1130		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1131		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1132		$(CH_2)_2-$	2	2	1	-	H		
1133		$(CH_2)_2-$	1	2	0	R	H		

1 2 6

Table 1.104

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\text{R}^4}$ $\text{R}^5$	$(CH_2)_q^- G - R^6$	
1134			1	2	0	R	H			
1135			1	2	0	R	H			
1136			1	2	0	R	H			
1137			1	2	0	R	H			
1138			1	2	0	R	H			
1139			1	2	0	R	H			
1140			1	2	0	R	H			
1141			1	2	0	R	H			
1142			1	2	0	R	H			
1143			1	2	0	R	H			
1144			1	2	0	R	H			

127

Table 1.105

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$\geq (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \\   \\ R^5 \end{array}$	$G-R^6$
1145			1	2	0	R	H			
1146			1	2	0	R	H			
1147			1	2	0	R	H			
1148			1	2	0	R	H			
1149			1	2	0	R	H			
1150			1	2	0	R	H			
1151			1	2	0	R	H			
1152			1	2	0	R	H			
1153			1	2	0	R	H			
1154			1	2	0	R	H			
1155			1	2	0	R	H			

128

Table 1.106

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C(R^5)- \end{array}$ $(CH_2)_q-G-R^6$
1156		1	2	0	R	H	
1157		1	2	0	R	H	
1158		1	2	0	R	H	
1159		1	2	0	R	H	
1160		1	2	0	R	H	
1161		1	2	0	R	H	
1162		1	2	0	R	H	
1163		1	2	0	R	H	
1164		1	2	0	R	H	
1165		1	2	0	R	H	
1166		1	2	0	R	H	

129

Table 1.107

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_k^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- (\text{CH}_2)_q^- \text{G-R}^6$
1167			2	2	1	-	H	
1168			1	2	0	R	H	
1169			1	2	0	R	H	
1170			1	2	0	R	H	
1171			1	2	0	R	H	
1172			1	2	0	R	H	
1173			1	2	0	R	H	
1174			1	2	0	R	H	
1175			1	2	0	R	H	
1176			1	2	0	R	H	
1177			1	2	0	R	H	

130

Table 1.108

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$ - $(\text{CH}_2)_q$ -G-R <sup>6</sup>
1178		1	2	0	R	H	
1179		1	2	0	R	H	
1180		1	2	0	R	H	
1181		1	2	0	R	H	
1182		1	2	0	R	H	
1183		1	2	0	R	H	
1184		1	2	0	R	H	
1185		1	2	0	R	H	
1186		1	2	0	R	H	
1187		2	2	1	-	H	
1188		2	2	1	-	H	

131

Table 1.109

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^4$ $\text{R}^5$	$\text{R}^6$			
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	$\text{G--}$				
1189		2	2	1	-	H	
1190		2	2	1	-	H	
1191		1	2	0	R	H	
1192		1	2	0	R	H	
1193		1	2	0	R	H	
1194		1	2	0	R	H	
1195		1	2	0	R	H	
1196		1	2	0	R	H	
1197		1	2	0	R	H	
1198		1	2	0	R	H	
1199		1	2	0	R	H	

1 3 2

Table 1.110

Compd. No.	$R^1$ $\text{---} \begin{array}{c} \diagup \\ \text{CH}_2 \end{array} \text{---} (CH_2)_j \text{---}$ $R^2$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ R^4 \\ \diagdown \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$ $\text{---} \begin{array}{c} \diagup \\ \text{CH}_2 \text{---} \text{N} \text{---} \text{C} \text{---} \text{O} \end{array} \text{---} \begin{array}{c} \diagup \\ \text{Cl} \end{array} \text{---} \text{C}_6\text{H}_3\text{Cl}_2$
1200		1	2	0	R	H	
1201		1	2	0	R	H	
1202		1	2	0	R	H	
1203		1	2	0	R	H	
1204		1	2	0	R	H	
1205		1	2	0	R	H	
1206		1	2	0	R	H	
1207		1	2	0	R	H	
1208		1	2	0	R	H	
1209		1	2	0	R	H	
1210		1	2	0	R	H	

133

Table 1.111

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$\text{R}^4$ $(\text{CH}_2)_q$	$\text{G}-\text{R}^6$
1211	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(F)cc(F)cc1</chem>
1212	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(F)cc1</chem>
1213	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(C(F)(F)F)cc1</chem>
1214	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(F)cc(C(F)(F)F)cc1</chem>
1215	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(Cl)cc(Cl)cc1</chem>
1216	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(F)cc(F)cc1</chem>
1217	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(C(F)(F)F)cc1</chem>
1218	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(CH3)cc1</chem>
1219	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(CH3)cc(Cl)cc1</chem>
1220	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(N)cc(I)cc1</chem>
1221	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	$\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H			<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1cc(C(F)(F)F)cc(F)cc(N)cc1</chem>

134

Table 1.112

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^4$ $\text{R}^5$ $(\text{CH}_2)_q$ G-R <sup>6</sup>
1222		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1223		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1224		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1225		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1226		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1227		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1228		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1229		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1230		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1231		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	
1232		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	

135

Table 1.113

Compd. No.	$R_1$ $R_2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ - \\ R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q-G-R^6$
1233		1	2	0	R	H	
1234		1	2	0	R	H	
1235		1	2	0	R	H	
1236		1	2	0	R	H	
1237		1	2	0	R	H	
1238		1	2	0	R	H	
1239		1	2	0	R	H	
1240		1	2	0	R	H	
1241		2	2	1	-	H	
1242		2	2	1	-	H	
1243		2	2	1	-	H	

1 3 6

Table 1.114

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1244		2	2	1	-	H	
1245		2	2	1	-	H	
1246		2	2	1	-	H	
1247		2	2	1	-	H	
1248		2	2	1	-	H	
1249		1	2	0	R	H	
1250		1	2	0	R	H	
1251		1	2	0	R	H	
1252		1	2	0	R	H	
1253		1	2	0	R	H	
1254		1	2	0	R	H	

137

Table 1.115

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1255		1	2	0	R	H	
1256		1	2	0	R	H	
1257		1	2	0	R	H	
1258		1	2	0	R	H	
1259		1	2	0	R	H	
1260		1	2	0	R	H	
1261		1	2	0	R	H	
1262		1	2	0	R	H	
1263		1	2	0	R	H	
1264		1	2	0	R	H	
1265		1	2	0	R	H	

Table 1.116

Compd. No.	$R_1$ $\begin{array}{c} \diagup \\ R_2 \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_i \text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \diagup \\ R_4 \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1266		1	2	0	R	H	
1267		1	2	0	R	H	
1268		1	2	0	R	H	
1269		1	2	0	R	H	
1270		1	2	0	R	H	
1271		1	2	0	R	H	
1272		1	2	0	R	H	
1273		1	2	0	R	H	
1274		1	2	0	R	H	
1275		1	2	0	R	H	
1276		1	2	0	R	H	

139

Table 1.117

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 - (CH_2)_j - \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1277		1	2	0	R	H	
1278		1	2	0	R	H	
1279		1	2	0	R	H	
1280		1	2	0	R	H	
1281		1	2	0	R	H	
1282		2	2	1	-	H	
1283		2	2	1	-	H	
1284		2	2	1	-	H	
1285		2	2	1	-	H	
1286		1	2	0	R	H	
1287		1	2	0	R	H	

140

Table 1.118

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R_5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1288		1	2	0	R	H	
1289		1	2	0	R	H	
1290		1	2	0	R	H	
1291		1	2	0	R	H	
1292		1	2	0	R	H	
1293		1	2	0	R	H	
1294		1	2	0	R	H	
1295		1	2	0	R	H	
1296		1	2	0	R	H	
1297		1	2	0	R	H	
1298		1	2	0	R	H	

141

Table 1.119

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1299		1	2	0	R	H	
1300		1	2	0	R	H	
1301		1	2	0	R	H	
1302		1	2	0	R	H	
1303		1	2	0	R	H	
1304		1	2	0	R	H	
1305		1	2	0	R	H	
1306		1	2	0	R	H	
1307		1	2	0	R	H	
1308		1	2	0	R	H	
1309		1	2	0	R	H	

142

Table 1.120

Compd. No.	$\begin{array}{c} R_1 \\   \\ R_2 \text{---} (CH_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R_4 \\   \\ R_5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1310		1	2	0	R	H	
1311		1	2	0	R	H	
1312		1	2	0	R	H	
1313		1	2	0	R	H	
1314		1	2	0	R	H	
1315		1	2	0	R	H	
1316		1	2	0	R	H	
1317		1	2	0	R	H	
1318		1	2	0	R	H	
1319		1	2	0	R	H	
1320		1	2	0	R	H	

143

Table 1.121

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{C}-(\text{CH}_2)_l-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-\text{C}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-R^6\end{array}$
1321	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1Br</chem>
1322	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1CH3</chem>
1323	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1I</chem>
1324	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1CH3</chem>
1325	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(C(=O)c2ccccc2)cc1</chem>
1326	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1O</chem>
1327	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1N</chem>
1328	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1Br</chem>
1329	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1CH3</chem>
1330	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1I</chem>
1331	<chem>CC(c1ccc(Cl)cc1)-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)-C(=O)c1ccc(Cl)cc1CH3</chem>

144

Table 1.122

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-C(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-C(CH_2)_q-G-R^6 \end{array}$
1332	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)C</chem>
1333	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)O</chem>
1334	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2cc(C)cc(N)cc2</chem>
1335	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)BrCl</chem>
1336	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)ClCH3</chem>
1337	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)ClI</chem>
1338	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)CH3</chem>
1339	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)C</chem>
1340	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)IHO</chem>
1341	<chem>CC1=CNC2=C1OC(C)=C2</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2cc(C)cc(N)cc2</chem>
1342	<chem>CC1=CC=CC=C1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccc(cc1)C(=O)c2ccc(cc2)BrCl</chem>

145

Table 1.123

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1343		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1344		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1345		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1346		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1347		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1348		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1349		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1350		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1351		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1352		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	
1353		$(\text{CH}_2)_1$	1	2	0	R	H	

1 4 6

Table 1.124

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$(\text{CH}_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
1354			2	2	1	-	H			
1355			1	2	0	R	H			
1356			1	2	0	R	H			
1357			1	2	0	R	H			
1358			2	2	1	-	H			
1359			1	2	0	R	H			
1360			1	2	0	R	H			
1361			1	2	0	R	H			
1362			1	2	0	R	H			
1363			1	2	0	R	H			
1364			1	2	0	R	H			

147

Table 1.125

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}- \end{array} \begin{array}{c} R^5 \\   \\ \text{H} \end{array} (\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1365		1	2	0	R	H	
1366		1	2	0	R	H	
1367		1	2	0	R	H	
1368		1	2	0	R	H	
1369		1	2	0	R	H	
1370		1	2	0	R	H	
1371		1	2	0	R	H	
1372		1	2	0	R	H	
1373		1	2	0	R	H	
1374		1	2	0	R	H	
1375		1	2	0	R	H	

148

Table 1.126

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - ( $\text{CH}_2$ ) $_j$ -	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1376		1	2	0	R	H	
1377		1	2	0	R	H	
1378		1	2	0	R	H	
1379		1	2	0	R	H	
1380		1	2	0	R	H	
1381		1	2	0	R	H	
1382		1	2	0	R	H	
1383		2	2	1	-	H	
1384		2	2	1	-	H	
1385		2	2	1	-	H	
1386		2	2	1	-	H	

1 4 9

Table 1.127

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
1387		1	2	0	R	H	
1388		1	2	0	R	H	
1389		1	2	0	R	H	
1390		1	2	0	R	H	
1391		1	2	0	R	H	
1392		1	2	0	R	H	
1393		1	2	0	R	H	
1394		1	2	0	R	H	
1395		1	2	0	R	H	
1396		1	2	0	R	H	
1397		1	2	0	R	H	

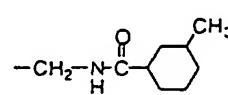
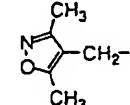
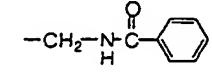
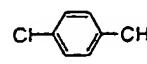
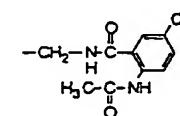
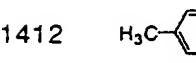
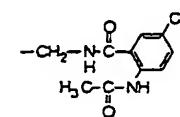
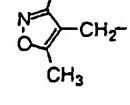
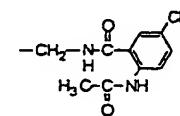
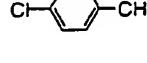
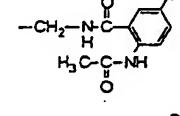
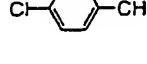
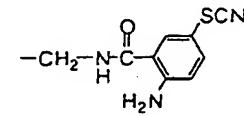
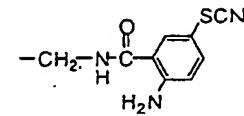
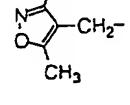
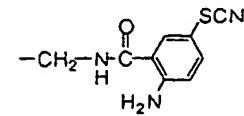
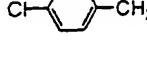
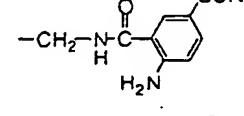
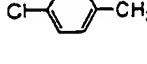
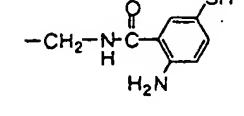
150

Table 1.128

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1398		1	2	0	R	H	
1399		1	2	0	R	H	
1400		1	2	0	R	H	
1401		1	2	0	R	H	
1402		1	2	0	R	H	
1403		1	2	0	R	H	
1404		1	2	0	R	H	
1405		1	2	0	R	H	
1406		1	2	0	R	H	
1407		1	2	0	R	H	
1408		1	2	0	R	H	

151

Table 1.129

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{C}(\text{CH}_2)_l-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5-\text{C}(\text{CH}_2)_q-\end{array} G-R^6$
1409		1	2	0	R	H	
1410		1	2	0	R	H	
1411		1	2	0	R	H	
1412		1	2	0	R	H	
1413		1	2	0	R	H	
1414		2	2	1	-	H	
1415		1	2	0	R	H	
1416		1	2	0	R	H	
1417		1	2	0	R	H	
1418		2	2	1	-	H	
1419		1	2	0	R	H	

152

Table 1.130

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\text{R}^4} \begin{array}{c}   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q^- G - R^6$
1420	$H_3C$		1	2	0	R	H	
1421			1	2	0	R	H	
1422			2	2	1	-	H	
1423			1	2	0	R	H	
1424			1	2	0	R	H	
1425			1	2	0	R	H	
1426			2	2	1	-	H	
1427			2	2	1	-	H	
1428			2	2	1	-	H	
1429			2	2	1	-	H	
1430			2	2	1	-	H	

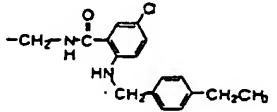
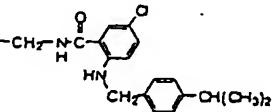
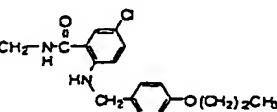
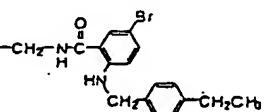
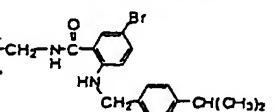
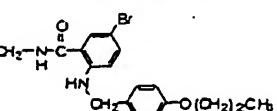
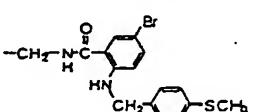
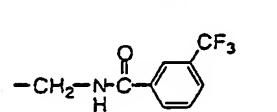
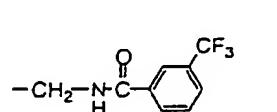
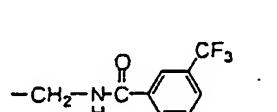
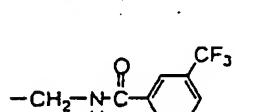
153

Table 1.131

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} R^2 \\   \\ CH_2-CH_2 \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p R^4$ $\begin{array}{c}   \\ R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q G-R^6$
1431	$H_3CCH_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$
1432	$O-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$
1433	$H_3CCH_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1434	$H_3CCH_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1435	$H_3CCH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{NH}_2$
1436	$(H_3C)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{NH}_2$
1437	$H_3C(CH_2)_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{NH}_2$
1438	$H_3CCH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$
1439	$(H_3C)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$
1440	$H_3C(CH_2)_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$
1441	$H_3CS-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{NH}_2$

154

Table 1.132

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1442	$H_3CCH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1443	$(H_3C)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1444	$H_3C(CH_2)_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1445	$H_3CCH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1446	$(H_3C)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1447	$H_3C(CH_2)_2O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1448	$H_3CS-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1449	$H_3CCH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1450	$(H_3C)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1451	$(H_3CCH_2)_2N-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	
1452	$H_3CO-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	

155

Table 1.133

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \\ \diagup \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}{\text{C}}-\text{CH}_2-\text{G}-\text{R}^6$
1453	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1454	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1455	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1456	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1457	$(\text{CH}_3)_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
1458	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
1459	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
1460	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Br}$
1461	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OC}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-$
1462	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}_2\text{N}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{OC}_6\text{H}_3(\text{OCH}_3)-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OH})_2-$
1463	$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	1	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\underset{\text{H}}{\text{N}}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$

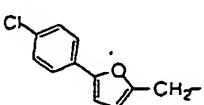
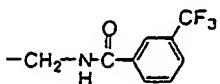
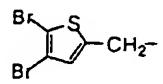
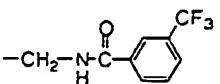
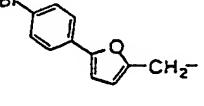
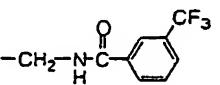
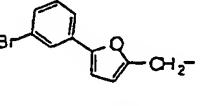
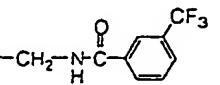
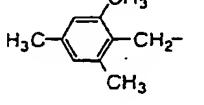
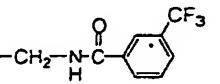
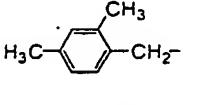
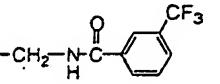
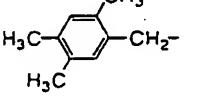
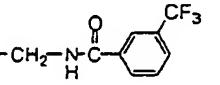
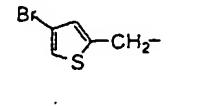
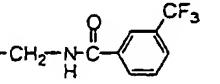
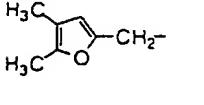
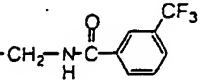
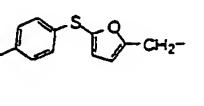
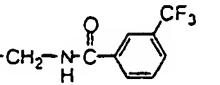
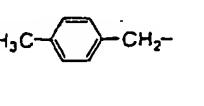
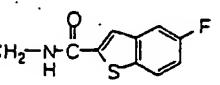
156

Table 1.134

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1464		2	1	1	-	H	
1465		2	1	1	-	H	
1466		2	1	1	-	H	
1467		2	1	1	-	H	
1468		2	1	1	-	H	
1469		2	1	1	-	H	
1470		2	1	1	-	H	
1471		2	1	1	-	H	
1472		1	2	0	R	H	
1473		1	2	0	R	H	
1474		1	2	0	R	H	

157

Table 1.135

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1475		1	2	0	R	H	
1476		1	2	0	R	H	
1477		1	2	0	R	H	
1478		1	2	0	R	H	
1479		1	2	0	R	H	
1480		1	2	0	R	H	
1481		1	2	0	R	H	
1482		1	2	0	R	H	
1483		1	2	0	R	H	
1484		1	2	0	R	H	
1485		1	2	0	R	H	

158

Table 1.136

Compd. No.	$R^1$ $R^2 > (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q G - R^6 \\   \\ R^5 \end{array}$
1486	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(O)cc1</chem>
1487	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(Cl)cc1</chem>
1488	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)C1CC1</chem>
1489	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)C1=CC=C1</chem>
1490	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(C)cc1</chem>
1491	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)C1CC1N</chem>
1492	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc([N+](=O)[O-])cc1</chem>
1493	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc2c(c1)OC2</chem>
1494	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc2c(c1)C[C@H]3[C@H]2C[C@H]3C</chem>
1495	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc2c(c1)CC2</chem>
1496	<chem>Cc1ccc(cc1)CC-</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc2c(c1)OC2</chem>

159

Table 1.137

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p^{\text{R}^4}$ $\text{R}^5$	$(\text{CH}_2)_q^-$ G-R <sup>6</sup>
1497			1	2	0	R	H		
1498			1	2	0	R	H		
1499			1	2	0	R	H		
1500			1	2	0	R	H		
1501			1	2	0	R	H		
1502			1	2	0	R	H		
1503			1	2	0	R	H		
1504			1	2	0	R	H		
1505			1	2	0	R	H		
1506			2	1	1	-	H		
1507			2	1	1	-	H		

160

Table 1.138

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1508		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	-	H	
1509		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	-	H	
1510		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	-	H	
1511		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	-	H	
1512		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	.	H	
1513		$(\text{CH}_2)_2$	2	1	1	-	H	
1514	$(\text{H}_3\text{CCH}_2)_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2)_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1515		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1516	$(\text{H}_3\text{CCH}_2)_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_2)_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1517		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	
1518		$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	

161

Table 1.139

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1519		2	2	1	-	H	
1520		1	2	0	R	H	
1521		1	2	0	R	H	
1522		1	2	0	R	H	
1523		1	2	0	R	H	
1524		1	2	0	R	H	
1525		1	2	0	R	H	
1526		1	2	0	R	H	
1527		1	2	0	R	H	
1528		1	2	0	R	H	
1529		1	2	0	R	H	

162

Table 1.140

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2 \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F},\text{CF}_3)-\text{CF}_3 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1530		1	2	0	R	H	
1531		1	2	0	R	H	
1532		1	2	0	R	H	
1533		1	2	0	R	H	
1534		1	2	0	R	H	
1535		1	2	0	R	H	
1536		1	2	0	R	H	
1537		1	2	0	R	H	
1538		1	2	0	R	H	
1539		1	2	0	R	H	
1540		1	2	0	R	H	

163

Table 1.141

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	$R^3$	$R^4$ $R^5$	$-(CH_2)_p$ $-(CH_2)_q$ G-R <sup>6</sup>
1541	H <sub>3</sub> CO	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1542		-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> O-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1543	H <sub>3</sub> CO	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1544	H <sub>3</sub> CO	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1545	Cl	-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1546		-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1547		-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Br <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>
1548	H <sub>3</sub> C	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1549	H <sub>3</sub> C	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1550	H <sub>3</sub> C	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH(Cl)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -OCH <sub>3</sub>
1551	H <sub>3</sub> C	-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H		-CH <sub>2</sub> -N(H)-C(=O)-S(=O)(=O)-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH) <sub>2</sub>

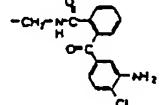
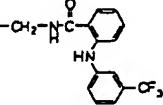
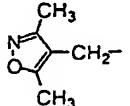
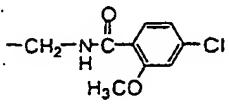
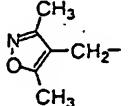
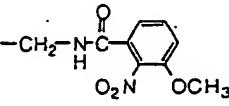
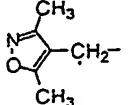
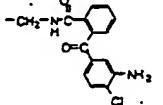
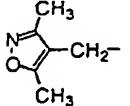
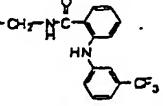
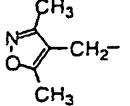
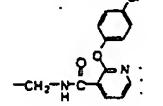
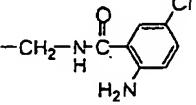
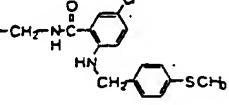
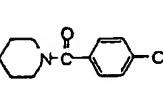
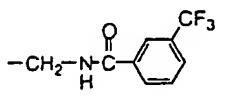
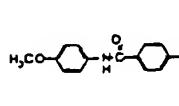
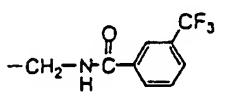
164

Table 1.142

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagdown \\ R^2 \\ \diagup \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-\text{CH}_2\text{C}_{\text{R}^5}^{\text{R}^4}\text{CH}_2\text{G}-\text{R}^6$
1552	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1ccccc1</chem>
1553	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N[C@@H]1C(=O)N2CCCCC1C2</chem>
1554	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc2c(c1)CCC2</chem>
1555	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1nc2c(n1)C(C)C</chem>
1556	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1nc2c(=O)[nH]c2[nH]1</chem>
1557	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1nc2sc(C)cn2</chem>
1558	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1nc2c(n1)C=CN2</chem>
1559	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc2c(n1)C(=O)C(C)(C)C</chem>
1560	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc2c([n+]([O-])=O)cc[n+]2=O</chem>
1561	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc2c(C(C)(C)C)cc(C(C)(C)C)cc2[nH]1</chem>
1562	<chem>Cc1ccc(cc1)CC</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc2c([n+]([O-])=O)c(O)cc2[nH]1</chem>

165

Table 1.143

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$	$(\text{CH}_2)_q$ -G-R <sup>6</sup>
1563	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R		H		
1564	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R		H		
1565		1	2	0	R		H		
1566		1	2	0	R		H		
1567		1	2	0	R		H		
1568		1	2	0	R		H		
1569		1	2	0	R		H		
1570	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-		H		
1571	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-		H		
1572		2	2	1	-		H		
1573		2	2	1	-		H		

166

Table 1.144

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	(CH <sub>2</sub> ) <sub>k</sub>	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C-R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
1574		-	2	2	1	-	H		
1575		-	2	2	1	-	H		
1576		-	2	2	1	-	H		
1577		-	2	2	1	-	H		
1578		-	2	2	1	-	H		
1579		-	2	2	1	-	H		
1580		-	2	2	1	-	H		
1581		-	2	2	1	-	H		
1582		-	2	2	1	-	H		
1583		-	1	2	0	R	H		
1584		-	1	2	0	R	H		

167

Table 1.145

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\text{R}^5$ - $(\text{CH}_2)_q$ -G-R <sup>6</sup>
1585		1	2	0	R	H	
1586		1	2	0	R	H	
1587		1	2	0	R	H	
1588		1	2	0	R	H	
1589		1	2	0	R	H	
1590		1	2	0	R	H	
1591		1	2	0	R	H	
1592		1	2	0	R	H	
1593		1	2	0	R	H	
1594		1	2	0	R	H	
1595		1	2	0	R	H	

168

Table 1.146

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1596		1	2	0	R	H	
1597		1	2	0	R	H	
1598		1	2	0	R	H	
1599		1	2	0	R	H	
1600		2	2	1	-	H	
1601		2	2	1	-	H	
1602		2	2	1	-	H	
1603		2	2	1	-	H	
1604		2	2	1	-	H	
1605		2	2	1	-	H	
1606		1	2	0	R	H	

169

Table 1.147

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \\ \diagdown \end{array} - (CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
1607	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)SC(F)(F)F</chem>
1608	<chem>CN1C(C)C=C(O)C1</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)SC(F)(F)F</chem>
1609	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)SC(F)(F)F</chem>
1610	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1611	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1612	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1613	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1614	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	1	2	0	R	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1615	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1)C(F)(F)F</chem>
1616	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1Cl)N</chem>
1617	<chem>CC(c1ccc(cc1)C)C</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-N(H)C(=O)c1ccc(cc1Br)N</chem>

170

Table 1.148

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ \text{C}-\text{R}^5 \end{array}$ $-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1618		1	2	0	R	H	
1619		1	2	0	R	H	
1620		1	2	0	R	H	
1621		1	2	0	R	H	
1622		1	2	0	R	H	
1623		1	2	0	R	H	
1624		1	2	0	R	H	
1625		1	2	0	R	H	
1626		1	2	0	R	H	
1627		1	2	0	R	H	
1628		1	2	0	R	H	

171

Table 1.149

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_j$ -	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1629	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)-\text{F}$
1630	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)$
1631	$\text{H}_2\text{NCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)$
1632	$\text{CF}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)$
1633	$\text{NC}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CN})-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)$
1634	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4\text{CF}_3)$
1635	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_3)$
1636	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_3)$
1637	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3)$
1638	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3)$
1639	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{N}}}(\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3)$

172

Table 1.150

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
1640		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{N}(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
1641		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{OCF}_2\text{CHClIF}$
1642		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{NO}_2$
1643		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{C}_6\text{H}_5$
1644		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5$
1645		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{CF}_3$
1646		$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{CF}_3$
1647	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{CF}_3$
1648	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{CF}_3$
1649	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{CF}_3$
1650	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$(\text{CH}_2)_2$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)_2-\text{CF}_3$

173

Table 1.151

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2\text{---}(CH_2)_j\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(CH_2)_q\text{G---R}^6$
1651	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1652	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1653	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1654	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1655	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1656	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_3\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1657	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1658	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1659	$\text{CH}_2\text{---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1660	$\text{Br---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1661	$\text{Br---C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	

174

Table 1.152

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2\text{C}(\text{CH}_2)_l$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_q\text{G-R}^6$
1662	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1663	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}_2$
1664	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}_2$
1665	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)_2-\text{N}_2$
1666	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1667	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_2(\text{Br})_2-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})_2-\text{O}$
1668	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1669	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{N}_2$
1670	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{N}_2$
1671	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)_2-\text{N}_2$
1672	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}_2$

175

Table 1.153

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^4$ $\text{R}^5$	$\text{R}^6$			
	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$		$\text{--}(\text{CH}_2)_q\text{--}$	$\text{G--R}^6$			
1673	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{--}\text{C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1674	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1675	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1676	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1677	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1678	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1679	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1680	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1681	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1682	$\text{F--C}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	
1683	$\text{C}_6\text{H}_5\text{--NHC}_6\text{H}_4\text{--CH}_2\text{--}$	2	2	1	-	H	

176

Table 1.154

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	k	m	n	chirality	$\text{R}^4$ $\text{R}^5$	$-(\text{CH}_2)_{j/p}(\text{CH}_2)_q\text{G}-\text{R}^6$
1684		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-$
1685		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-$
1686		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-$
1687		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})-$
1688		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})-$
1689		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCF}_3)-$
1690		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)-$
1691		H	2	2	1	-		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{Cl})-$
1692		H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{C}(\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-$
1693		H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-$
1694		H	1	2	0	R		$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})-$

177

Table 1.155

Compd. No.	$R_1^1$ $\swarrow$ $R_2^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\text{R}^4}$ $\text{R}^5$ $(CH_2)_q^- G - R^6$
1695		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1696		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1697		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1698		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1699		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1700		$CH_3$	1	2	0	R	H	
1701		$CH_2-$	1	2	0	R	H	
1702		$CH_2-$	1	2	0	R	H	
1703		$CH_2-$	1	2	0	R	H	
1704		$CH_2-$	1	2	0	R	H	
1705		$CH_2-$	1	2	0	R	H	

178

Table 1.156

Compd. No.	$R_1^1$ $R_2^2$	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^R_5^R_4^R_5^R_6^G-R^6$
1706		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1707		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1708		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1709		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1710		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1711		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1712		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1713		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1714		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1715		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	
1716		$(CH_2)_j^-$	1	2	0	R	H	

179

Table 1.157

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
1717		$\text{OCH}_3$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1718		$\text{CH}_3$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1719		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1720		$\text{HOOC-C(=O)-CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1721		$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1722		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1723		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1724		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1725		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1726		$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$
1727		$\text{CH}_2^-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$

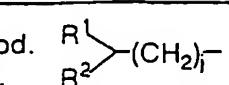
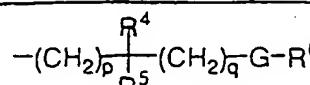
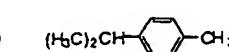
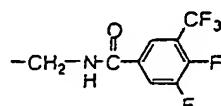
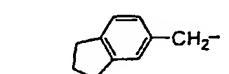
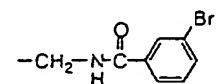
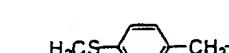
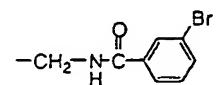
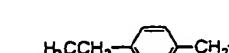
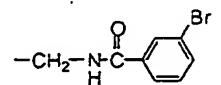
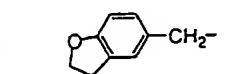
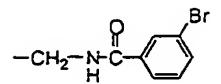
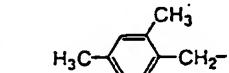
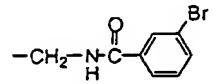
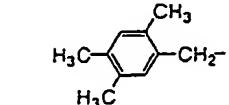
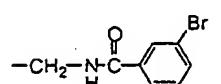
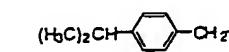
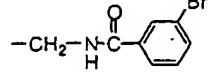
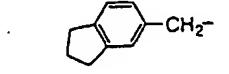
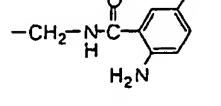
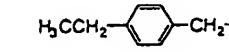
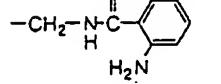
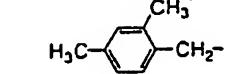
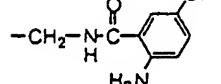
180

Table 1.158

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1728		1	2	0	R	H	
1729		1	2	0	R	H	
1730		1	2	0	R	H	
1731		1	2	0	R	H	
1732		1	2	0	R	H	
1733		1	2	0	R	H	
1734		1	2	0	R	H	
1735		1	2	0	R	H	
1736		1	2	0	R	H	
1737		1	2	0	R	H	
1738		1	2	0	R	H	

181

Table 1.159

Compd. No.		k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	
1739		1	2	0	R	H	
1740		1	2	0	R	H	
1741		1	2	0	R	H	
1742		1	2	0	R	H	
1743		1	2	0	R	H	
1744		1	2	0	R	H	
1745		1	2	0	R	H	
1746		1	2	0	R	H	
1747		1	2	0	R	H	
1748		1	2	0	R	H	
1749		1	2	0	R	H	

182

Table 1.160

Compd. No.	$R_1$ $\text{R}_2\text{---}(CH_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{ }}(CH_2)_q\text{---G---R}^6$
1750		1	2	0	R	H	
1751	$\text{H}_3\text{CS---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1752	$\text{H}_3\text{CCH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1753		1	2	0	R	H	
1754		1	2	0	R	H	
1755		1	2	0	R	H	
1756	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1757		1	2	0	R	H	
1758		1	2	0	R	H	
1759		1	2	0	R	H	
1760		1	2	0	R	H	

## 183

Table 1.161

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\overset{\text{R}^4}{ }}{\underset{\overset{\text{R}^5}{ }}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1761	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$
1762	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$
1763	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1764	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1765	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	$(S)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1766	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2-$	2	2	0	-	H	$(R)-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_5-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1767	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1768	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	3	1	-	H	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{OCH}_2\text{CH}_3$
1769	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)-\text{O}$
1770	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}_6\text{Cl}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{O}$
1771	$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}$

184

Table 1.162

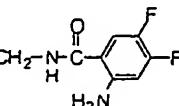
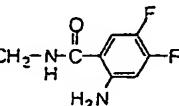
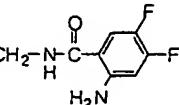
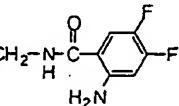
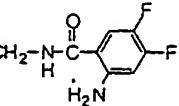
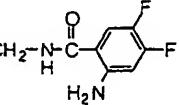
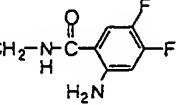
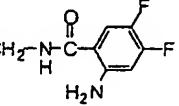
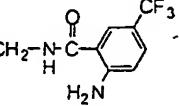
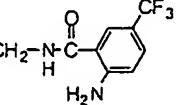
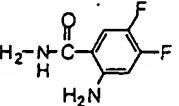
Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$ - $(\text{CH}_2)_j$ -	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1772		1	2	0	R	H	
1773		1	2	0	R	H	
1774		1	2	0	R	H	
1775		1	2	0	R	H	
1776		1	2	0	R	H	
1777		2	2	1	-	H	
1778		2	2	1	-	H	
1779		2	2	1	-	H	
1780		2	2	1	-	H	
1781		2	2	1	-	H	
1782		2	2	1	-	H	

Table 1.163

Compd. No.	$R^1$ $\text{---}R^2\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p\text{---}\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
1783		2	2	1	-	H	
1784		2	2	1	-	H	
1785	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{phenyl---CH}_2\text{---}$	2	2	1	-	H	
1786		2	2	1	-	H	
1787	$\text{CH}_3(\text{CH}_2)_2\text{---}\text{phenyl---CH}_2\text{---}$	1	2	0	R	H	
1788		2	2	1	-	H	
1789		2	2	1	-	H	
1790		1	2	0	S	H	
1791		1	2	0	S	H	
1792		2	2	1	-	H	
1793		2	2	1	-	H	

186

Table 1.164

Compd. No.	$R^1$ $R^2>(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \end{array}$ G-R <sup>6</sup>
1794	$H_3C-$  -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1795	 -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1796	 -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1797	 -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1798	$H_3CO-$  -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1799	$H_2C=\text{CH}-$  -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1800	$\text{NC}-$  -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1801	 -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1802	$H_3C\text{CH}_2\text{O}-$  -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1803	$H_3C-$  -CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 
1804	$H_3C(\text{CH}_2)_2-$  -CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-$ 

187

Table 1.165

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2\text{---}(CH_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{---}}}(CH_2)_q\text{---G---R}^6$
1805		1	2	0	R	H	
1806		1	2	0	R	H	
1807		1	2	0	R	H	
1808		1	2	0	R	H	
1809		1	2	0	R	H	
1810		1	2	0	R	H	
1811		1	2	0	R	H	
1812		1	2	0	R	H	
1813		1	2	0	R	H	
1814		1	2	0	R	H	
1815		1	2	0	R	H	

## 188

Table 1.166

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1816	$(\text{CH}_3)_2\text{C}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{SCF}_3$
1817	$(\text{CH}_3)_3\text{C}-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{SCF}_3$
1818	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1819	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1820	$\text{HO}-\overset{\text{H}_3\text{CO}}{\text{C}_6\text{H}_3}-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1821	$\text{HO}-\overset{\text{H}_3\text{CO}}{\text{C}_6\text{H}_3}-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1822	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1823	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1824	$\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1825	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$
1826	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}(\text{SCF}_3)-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$

189

Table 1.167

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $R^4$ $R^5$ $(CH_2)_q$ G-R <sup>6</sup>
1827		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-OCHF_2$
1828		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-OCHF_2$
1829		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-OCHF_2$
1830		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-OCHF_2$
1831		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1832		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1833		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1834		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1835		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1836		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$
1837		$CH_2^-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-C_6H_4-C(CH_3)_3$

190

Table 1.168

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \\   \\ R^5 \end{array}$	G-R <sup>6</sup>
1838	<chem>H3CS-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1839	<chem>H3CCH2-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1840	<chem>c1ccccc1-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1841	<chem>H3C-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1842	<chem>H3C-c1ccc(cc1)-CH3</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1843	<chem>(CH3)2CH-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1844	<chem>(CH3)3C-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(C)(C)C</chem>	
1845	<chem>H3CCH2-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)c2cc(Br)n(c2)Cc3ccccc3CC</chem>	
1846	<chem>H3C-c1ccc(cc1)-CH3</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)SC(F)(F)F</chem>	
1847	<chem>(CH3)3C-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)OC(F)(F)F</chem>	
1848	<chem>H3CO-c1ccc(cc1)-</chem>	$-CH_2-$	1	2	0	R	H	$-CH_2-$	<chem>Nc1ccccc1C(=O)c2ccccc2</chem>	

## 191

Table 1.169

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \end{array}$ $R^5$	$G-R^6$
1849		1	2	0	R	H		
1850	$H_3CCH_2-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		
1851	$H_3C-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		
1852		1	2	0	R	H		
1853	$H_3CO-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		
1854		1	2	0	R	H		
1855	$H_3CCH_2-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		
1856	$H_3C-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		
1857		1	2	0	R	H		
1858		1	2	0	R	H		
1859	$H_3CO-\text{phenyl}-CH_2-$	1	2	0	R	H		

## 192

Table 1.170

Compd. No.	$R_1^1$ $R_2^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^R_4^R_5^R_6^G-R^6$
1860		1	2	0	R	H	
1861		1	2	0	R	H	
1862		1	2	0	R	H	
1863		1	2	0	R	H	
1864		1	2	0	R	H	
1865		1	2	0	R	H	
1866		1	2	0	R	H	
1867		1	2	0	R	H	
1868		1	2	0	R	H	
1869		1	2	0	R	H	
1870		1	2	0	R	H	

## 193

Table 1.171

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\substack{R^4 \\  }}{\underset{R^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1871		1	2	0	R	H	
1872		1	2	0	R	H	
1873		1	2	0	R	H	
1874		1	2	0	R	H	
1875		1	2	0	R	H	
1876		1	2	0	R	H	
1877		1	2	0	R	H	
1878		1	2	0	R	H	
1879		1	2	0	R	H	
1880		1	2	0	R	H	
1881		1	2	0	R	H	

## 194

Table 1.172

Compd. No.	$R^1$ $\text{---} \begin{array}{c} > \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{C}(\text{H}_2)_j \end{array} \text{---} R^2$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \text{R}^4 \quad \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1882		1	2	0	R	H	
1883		1	2	0	R	H	
1884		1	2	0	R	H	
1885		1	2	0	R	H	
1886		1	2	0	R	H	
1887		1	2	0	R	H	
1888		1	2	0	R	H	
1889		1	2	0	R	H	
1890		1	2	0	R	H	
1891		1	2	0	R	H	
1892		1	2	0	R	H	

## 195

Table 1.173

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p$	$\begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ \text{R}^5 \end{array}$	$(\text{CH}_2)_q$	G	$\text{R}^6$
1893		$(\text{CH}_2)_j$	1	2	0	R	H					
1894	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1895	$(\text{CH}_3)_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1896			1	2	0	R	H					
1897	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1898	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1899	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1900			1	2	0	R	H					
1901	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		1	2	0	R	H					
1902			1	2	0	R	H					
1903	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$		2	2	1	-	H					

## 196

Table 1.174

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} R^2 \\ \diagdown \\ \diagup \\ -\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2-\end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\substack{R^4 \\  }}{\underset{R^5}{\text{C}}}(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
1904	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1905	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1906	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1907	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1908	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1909	$\text{H}_2\text{C}\equiv\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1910	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1911	$\text{Cl}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1912	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1913	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$
1914	$\text{H}_3\text{C}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\overset{\substack{\text{O} \\   }}{\text{N}}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{OCF}_3$ $\text{H}_2\text{N}$

## 197

Table 1.175

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (CH_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
1915		1	2	0	R	H	
1916		1	2	0	R	H	
1917		2	2	1	-	H	
1918		2	2	1	-	H	
1919		2	2	1	-	H	
1920		2	2	1	-	H	
1921		1	2	0	R	H	
1922		2	2	1	-	H	
1923		2	2	1	-	H	
1924		2	2	1	-	H	
1925		2	2	1	-	H	

198

Table 1.176

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p R^4$ $\text{---} \begin{array}{c}   \\ R^5 \\   \\ -G-R^6 \end{array}$ $(CH_2)_q^-$
1926			2	2	1	-	H	
1927			2	2	1	-	H	
1928			2	2	1	-	H	
1929			2	2	1	-	H	
1930			2	2	1	-	H	
1931			2	2	1	-	H	
1932			2	2	1	-	H	
1933			2	2	1	-	H	
1934			2	2	1	-	H	
1935			2	2	1	-	H	
1936			2	2	1	-	H	

199

Table 1.177

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (CH_2)_l \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1937	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH---C(=O)---CH <sub>2</sub> ---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1938	B---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1939	H <sub>3</sub> CO---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1940	F---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1941	F---C <sub>6</sub> H <sub>2</sub> (F)-CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1942	HO---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1943	O---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1944	Cyclohexene---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1945	H <sub>3</sub> CS---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1946	H <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub> ---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	
1947	O---C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ---CH <sub>2</sub> ---	2	2	1	-	H	

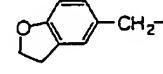
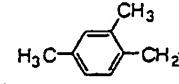
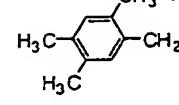
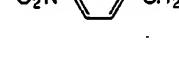
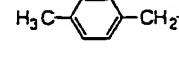
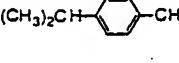
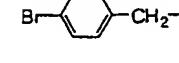
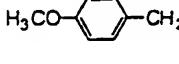
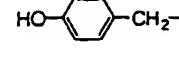
Table 1.178

200

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\text{ }} \overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}} (CH_2)_q^- G - R^6$
1948		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1949		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1950		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1951		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1952		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1953		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1954		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1955		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1956		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1957		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	
1958		$CH_2^-$	2	2	1	-	H	

201

Table 1.179

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} R^2 \\   \\ -CH_2- \end{array}$	$k$	$m$	$n$	chirality	$R^3$	$-CH_2-p\begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array}-CH_2-qG-R^6$
1959	$H_3CS-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1960	$H_3CCH_2-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1961		2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1962	$H_3C-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1963	$H_3C-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1964	$O_2N-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1965	$H_3C-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1966	$(CH_3)_2CH-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})F$
1967	$Br-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(F)_2\text{N}_2$
1968	$H_3CO-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(F)_2\text{N}_2$
1969	$HO-$ 	2	2	1	-	H	$-CH_2-N(H)-C(=O)-\text{C}_6\text{H}_3(F)_2\text{N}_2$

## 202

Table 1.180

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - ( $CH_2$ ) <sub>i</sub> -	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \end{array}$ $\begin{array}{c} R^5 \\   \\ G-R^6 \end{array}$
1970		2	2	1	-	H	
1971		2	2	1	-	H	
1972		2	2	1	-	H	
1973		2	2	1	-	H	
1974		2	2	1	-	H	
1975		2	2	1	-	H	
1976		2	2	1	-	H	
1977		2	2	1	-	H	
1978		2	2	1	-	H	
1979		2	2	1	-	H	
1980		2	2	1	-	H	

203

Table 1.181

Compd. No.	$R^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c}   \\ R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- G - R^6$
1981	$\text{O}_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{O}_2\text{N}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{NH}_2$
1982	$\text{NC}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{NC}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{NH}_2$
1983	$(\text{CH}_3)_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$(\text{CH}_3)_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{F})_2-\text{NH}_2$
1984	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{Br}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1985	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{H}_3\text{CO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1986	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{HO}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1987	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1988	$\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	$\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1989	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{H}_3\text{CS}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1990	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	$\text{H}_3\text{CCH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$
1991	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	$\text{O}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{O})-\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{I})_2-\text{NH}_2$

204

Table 1.182

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_i -$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1992		2	2	1	-	H	
1993		2	2	1	-	H	
1994		2	2	1	-	H	
1995		2	2	1	-	H	
1996		2	2	1	-	H	
1997		2	2	1	-	H	
1998		2	2	1	-	H	
1999		2	2	1	-	H	
2000		2	2	1	-	H	
2001		2	2	1	-	H	
2002		2	2	1	-	H	

205

Table 1.183

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$(\text{CH}_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$\text{R}^3$	$-(\text{CH}_2)_p^- \begin{array}{c} \text{R}^4 \\   \\ \text{C} \\   \\ \text{R}^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q^- \text{G}-\text{R}^6$
2003		$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2004	$\text{H}_3\text{CS}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2005	$\text{H}_3\text{CCH}_2-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2006	$\text{H}_3\text{C}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2007	$\text{O}_2\text{N}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2008	$\text{H}_3\text{C}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2009	$\text{NC}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2010	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2011	$\text{H}_3\text{C}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$
2012	$\text{Br}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{Cl}$
2013	$\text{H}_3\text{CO}-$	$\text{CH}_2-$	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})-\text{Cl}$

206

Table 1.184

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2014	<chem>Oc1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2015	<chem>Oc1ccc(cc1)Cc2ccccc2</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2016	<chem>C1=CC=C2C=C1C=C2Cc3ccccc3</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2017	<chem>CS(=O)c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2018	<chem>CC(=O)c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2019	<chem>Oc1ccc(cc1)Cc2ccccc2</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2020	<chem>CC(C)c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2021	<chem>O=[N+]([O-])c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2022	<chem>CC(C)c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2023	<chem>C#Nc1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>
2024	<chem>CC(C)(C)c1ccc(CC)c1</chem>	2	2	1	-	H	<chem>-CH2-NHC(=O)c1cc(Cl)cc(Br)cc1</chem>

## 207

Table 1.185

Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} \diagup \\ R^2-C-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p\begin{array}{c} \diagup \\ R^4 \\   \\ R^5 \end{array}(CH_2)_q-G-R^6$
2025		2	2	1	-	H	
2026		2	2	1	-	H	
2027		2	2	1	-	H	
2028		2	2	1	-	H	
2029		2	2	1	-	H	
2030		2	2	1	-	H	
2031		2	2	1	-	H	
2032		2	2	1	-	H	
2033		2	2	1	-	H	
2034		2	2	1	-	H	
2035		2	2	1	-	H	

## 208

Table 1.186

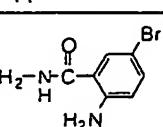
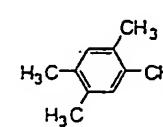
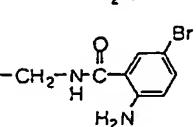
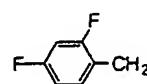
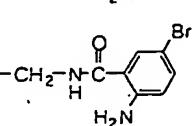
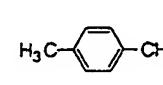
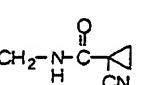
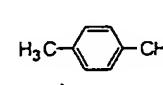
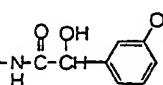
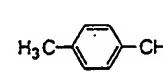
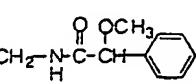
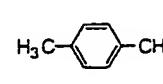
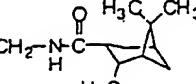
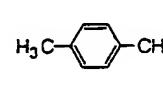
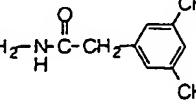
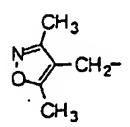
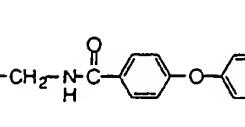
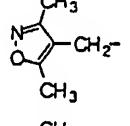
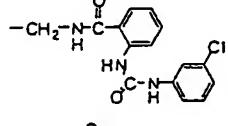
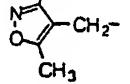
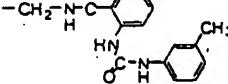
Compd. No.	$R^1$ $\begin{array}{c} R^2 \\   \\ -CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
2036	N≡C- 	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2037		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2038		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2039		2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2040		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{OH})-$ 
2041		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{OCOCH}_3)-$ 
2042		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2043		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-$ 
2044		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2045		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 
2046		1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})-$ 

Table 1.187

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2-CH_2-(CH_2)_j- \end{array}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_{l/p} \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_{q} G-R^6$
2047		1	2	0	R	H	
2048		1	2	0	R	H	
2049		1	2	0	R	H	
2050		1	2	0	R	H	
2051		1	2	0	R	H	
2052		2	2	1	-	H	
2053		2	2	1	-	H	
2054		2	2	1	-	H	
2055		2	2	1	-	H	
2056		2	2	1	-	H	
2057		2	2	1	-	H	

210

Table 1.188

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\text{R}^4}-N(H)-C(=O)-C_6H_3(F)_2-NH_2-$ $-(CH_2)_q^{\text{R}^5}-G-R^6$
2058		2	2	1	-	H	
2059		2	2	1	-	H	
2060		2	2	1	-	H	
2061		2	2	1	-	H	
2062		2	2	1	-	H	
2063		2	2	1	-	H	
2064		2	2	1	-	H	
2065		2	2	1	-	H	
2066		2	2	1	-	H	
2067		2	2	1	-	H	
2068		2	2	1	-	H	

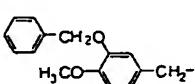
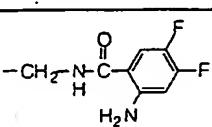
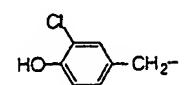
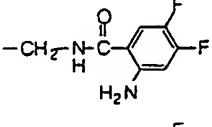
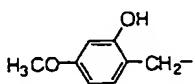
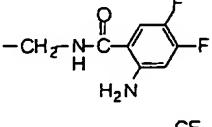
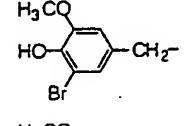
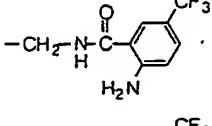
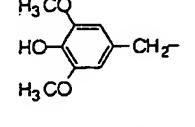
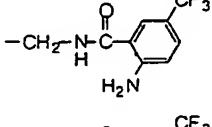
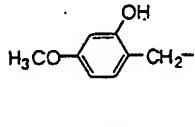
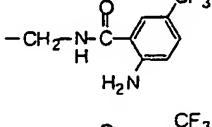
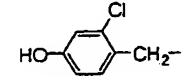
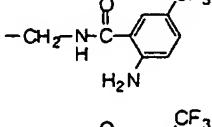
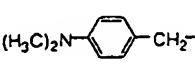
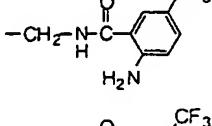
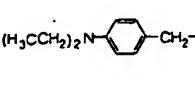
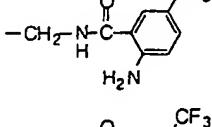
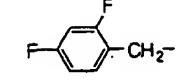
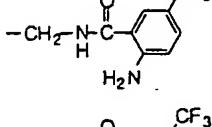
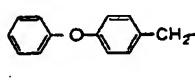
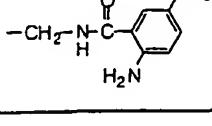
211

Table 1.189

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^R^4$ $R^5$	$(CH_2)_q^-G-R^6$
2069		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2070		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2071		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2072	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CHO}$	$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2073		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2074		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2075		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2076		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2077		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2078		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$
2079		$(CH_2)_j^-$	2	2	1	-	H		$-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{F}_3\text{NH}_2$

212

Table 1.190

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C(=O)-C_6H_3(F, F)-N(H) \\   \\ H_2N \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
2080		2	2	1	-	H	
2081		2	2	1	-	H	
2082		2	2	1	-	H	
2083		1	2	0	R	H	
2084		1	2	0	R	H	
2085		1	2	0	R	H	
2086		1	2	0	R	H	
2087		1	2	0	R	H	
2088		1	2	0	R	H	
2089		1	2	0	R	H	
2090		1	2	0	R	H	

213

Table 1.191

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{---}(\text{CH}_2)_l\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2091	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2092	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2093	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2094	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2095	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2096	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2097	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2098	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2099	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2100	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	
2101	$\text{CH}_2\text{---}\text{C}_6\text{H}_4\text{---}\text{CH}_2^-$	2	2	1	-	H	

214

Table 1.192

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\overset{R^4}{\underset{R^5}{ }}(CH_2)_q-G-R^6$
2102		2	2	1	-	H	
2103		2	2	1	-	H	
2104		2	2	1	-	H	
2105		2	2	1	-	H	
2106		2	2	1	-	H	
2107		2	2	1	-	H	
2108		2	2	1	-	H	
2109		2	2	1	-	H	
2110		2	2	1	-	H	
2111		2	2	1	-	H	
2112		2	2	1	-	H	

215

Table 1.193

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)$ <sub>j</sub>	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C- \\   \\ R^5 \end{array}$	$(CH_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
2113		-	2	2	1	-	H	-		-	
2114		-	2	2	1	-	H	-		-	
2115		-	2	2	1	-	H	-			
2116		-	2	2	1	-	H	-			
2117		-	2	2	1	-	H	-			
2118		-	1	2	0	R	H	-		-	
2119		-	1	2	0	R	H	-		-	
2120		-	1	2	0	R	H	-		-	
2121		-	1	2	0	R	H	-		-	
2122		-	1	2	0	R	H	-		-	
2123		-	1	2	0	R	H	-		-	

216

Table 1.194

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^R^4$ $\text{---} C(R_5) \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2124			1	2	0	R	H	
2125			1	2	0	R	H	
2126			1	2	0	R	H	
2127			1	2	0	R	H	
2128			1	2	0	R	H	
2129			1	2	0	R	H	
2130			2	2	1	-	H	
2131			2	2	1	-	H	
2132			1	2	0	R	H	
2133			1	2	0	R	H	
2134			1	2	0	R	H	

217

Table 1.195

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C(=O)-N(H)-C(=O)- \\   \\ H_2N \end{array} (CH_2)_q G - R^6$
2135	(H <sub>3</sub> C) <sub>2</sub> N H <sub>3</sub> CO-phenyl-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2136	(H <sub>3</sub> C) <sub>2</sub> N H <sub>3</sub> C-phenyl-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2137	CH <sub>3</sub> Cl-phenyl-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2138	CH <sub>3</sub> 2-phenyl-4-methylimidazol-5-yl-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2139	CH <sub>3</sub> 2-chloro-4,6-dimethylimidazol-5-yl-CH <sub>2</sub> -	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2140	O-phenyl-CH <sub>2</sub> -NH <sub>2</sub>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{F}_4-\text{N}(\text{H}_2)$
2141	H <sub>2</sub> N-phenyl-CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{F}_4-\text{N}(\text{H}_2)$
2142	H <sub>2</sub> N-Cl-phenyl-CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{F}_4-\text{N}(\text{H}_2)$
2143	O-phenyl-CH <sub>2</sub> -HN-C(=O)-CH <sub>3</sub>	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{F}_4-\text{N}(\text{H}_2)$
2144	H <sub>3</sub> CO-phenyl-CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$
2145	H <sub>2</sub> N-phenyl-CH <sub>2</sub> -	2	2	1	-	H	$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_6\text{H}_3(\text{CF}_3)_2-\text{N}(\text{H}_2)$

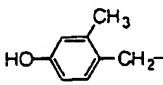
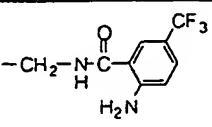
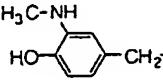
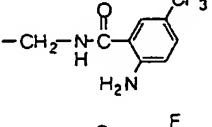
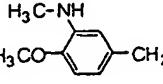
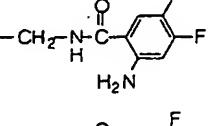
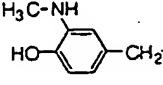
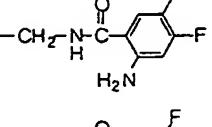
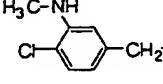
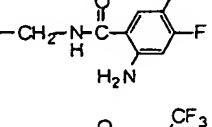
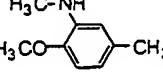
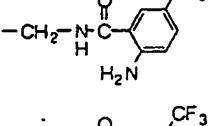
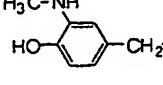
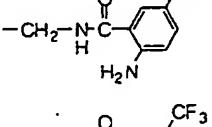
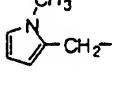
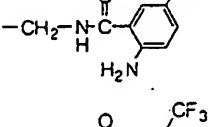
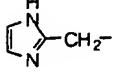
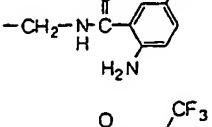
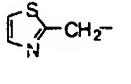
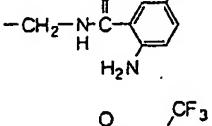
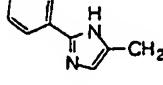
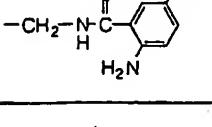
218

Table 1.196

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^{\cdot} \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C- \\   \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q^- G - R^6$
2146		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	
2147		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	
2148		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	
2149		$-(CH_2)_1^-$	1	2	0	R	H	
2150		$-(CH_2)_1^-$	1	2	0	R	H	
2151		$-(CH_2)_1^-$	1	2	0	R	H	
2152		$-(CH_2)_1^-$	1	2	0	R	H	
2153		$-(CH_2)_1^-$	1	2	0	R	H	
2154		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	
2155		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	
2156		$-(CH_2)_2^-$	2	2	1	-	H	

219

Table 1.197

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C- \\   \\ R^5 \end{array}$ $(CH_2)_q-G-R^6$
2157		1	2	0	R	H	
2158		1	2	0	R	H	
2159		2	2	1	-	H	
2160		2	2	1	-	H	
2161		2	2	1	-	H	
2162		2	2	1	-	H	
2163		2	2	1	-	H	
2164		1	2	0	R	H	
2165		1	2	0	R	H	
2166		1	2	0	R	H	
2167		1	2	0	R	H	

220

Table 1.198

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q \\   \\ R^5 \end{array}$	G-R <sup>6</sup>
2168		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2169		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2170		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2171		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2172		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2173		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2174		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2175		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2176		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2177		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			
2178		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H			

221

Table 1.199

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(R^4)(R^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
2179		1	2	0	R	H	
2180		1	2	0	R	H	
2181		1	2	0	R	H	
2182		1	2	0	R	H	
2183		1	2	0	R	H	
2184		2	2	1	-	H	
2185		2	2	1	-	H	
2186		2	2	1	-	H	
2187		1	2	0	R	H	
2188		2	2	1	-	H	
2189		1	2	0	R	H	

222

Table 1.200

Compd. No.	$\text{R}^1$ $\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^4$ $\text{R}^5$	$\text{R}^6$			
	$\text{--}(\text{CH}_2)_k\text{--}$	$\text{m}$	$\text{n}$	chirality	$\text{--}(\text{CH}_2)_p\text{--}$	$\text{G--R}^6$	
2190		2	2	1	-	H	
2191		2	2	1	-	H	
2192		2	2	1	-	H	
2193		2	2	1	-	H	
2194		2	2	1	-	H	
2195		2	2	1	-	H	
2196		1	2	0	R	H	
2197		1	2	0	R	H	
2198		1	2	0	R	H	
2199		2	2	1	-	H	
2200		2	2	1	-	H	

Table 1.201

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$	$\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C(R^5)- \\   \\ CH_2 \end{array}$	$(CH_2)_q$	G-R <sup>6</sup>
2201		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2202		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2203		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2204		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2205		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2206		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2207		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2208		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2209		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2210		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	
2211		$(CH_2)_2$	2	2	1	-	H	$-(CH_2)_p$		$(CH_2)_q$	

Table 1.202

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \\   \\ R^5 \end{array}$
2212		2	2	1	-	H	
2213		2	2	1	-	H	
2214		2	2	1	-	H	
2215		1	2	0	R	H	
2216		1	2	0	R	H	
2217		1	2	0	R	H	
2218		1	2	0	R	H	
2219		1	2	0	R	H	
2220		1	2	0	R	H	
2221		1	2	0	R	H	
2222		1	2	0	R	H	

Table 1.203

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{CH}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
2223	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2224	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2225	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2226	<chem>CN1C(Cl)=NC(C1=CC=C(C=C1)CH2-)=C1C(Cl)=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2227	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2228	<chem>CC1=CC=C(C=C1)CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2229	<chem>CC1=CC(O)=CC=C1CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2230	<chem>CC1=CC(C)=CC=C1CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2231	<chem>CC1=CC(C)=CC=C1CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2232	<chem>CC1=CC(C)=CC=C1CH2-</chem>	1	2	0	R	H	
2233	<chem>c1cc2ccccc2n1</chem>	1	2	0	R	H	

Table 1.204

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j$ -	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \end{array}$
2234		1	2	0	R	H	
2235		1	2	0	R	H	
2236		1	2	0	R	H	
2237		1	2	0	R	H	
2238		1	2	0	R	H	
2239		1	2	0	R	H	
2240		1	2	0	R	H	
2241		1	2	0	R	H	
2242		1	2	0	R	H	
2243		1	2	0	R	H	
2244		1	2	0	R	H	

227

Table 1.205

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ -\text{C}- \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{G-R}^6$
2245		1	2	0	R	H	
2246		1	2	0	R	H	
2247		1	2	0	R	H	
2248		1	2	0	R	H	
2249		1	2	0	R	H	
2250		1	2	0	R	H	
2251		1	2	0	R	H	
2252		2	2	1	-	H	
2253		2	2	1	-	H	
2254		2	2	1	-	H	
2255		2	2	1	-	H	

Table 1.206

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ $\text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2256		2	2	1	-	H	
2257		2	2	1	-	H	
2258		1	2	0	R	H	
2259		1	2	0	R	H	
2260		1	2	0	R	H	
2261		1	2	0	R	H	
2262		1	2	0	R	H	
2263		1	2	0	S	H	
2264		1	2	0	S	H	
2265		1	2	0	S	H	
2266		1	2	0	S	H	

Table 1.207

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^-(CH_2)_q^-(CH_2)_q^G-R^6$
2267		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2268		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2269		$H_3CS-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2270		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2271		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2272		$H_3CS-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2273		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2274		$H_3CS-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2275		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2276		$Cl$ $-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	
2277		$H_3CS-C_6H_4-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	

Table 1.208

Compd. No.	$R_1^1$ $R_2^2$	$(CH_2)_l^-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p^4$ $\text{R}_5^5$	$-(CH_2)_q^6$ -G-R $^6$
2278		$-(CH_2)_l^-$	1	2	0	R	H		
2279		$-(CH_2)_l^-$	1	2	0	R	H		
2280		$-(CH_2)_l^-$	1	2	0	S	H		
2281		$-(CH_2)_l^-$	1	2	0	S	H		
2282		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2283		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2284		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2285		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2286		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2287		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		
2288		$-(CH_2)_l^-$	2	2	1	-	H		

Table 1.209

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -CH-N-C(=O)-N(H) \\   \\ H \end{array}$ $(CH_2)_q G-R^6$
2289		2	2	1	-	H	
2290		2	2	1	-	H	
2291		2	2	1	-	H	
2292		2	2	1	-	H	
2293		2	2	1	-	H	
2294		2	2	1	-	H	
2295		2	2	1	-	H	
2296		1	2	0	R	H	
2297		1	2	0	R	H	
2298		1	2	0	R	H	
2299		1	2	0	R	H	

Table 1.210

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$(CH_2)_j$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -CH-N-C(=O)- \\   \\ H \end{array}$ $R^5$ $(CH_2)_q$ G-R <sup>6</sup>
2300		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	
2301		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	
2302		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	
2303		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	
2304		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	
2305		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	
2306		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	
2307		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	
2308		$(CH_2)_2$	1	2	0	R	H	
2309		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	
2310		$(CH_2)_2$	1	2	0	S	H	

Table 1.211

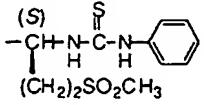
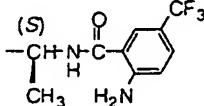
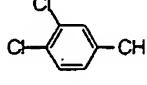
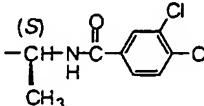
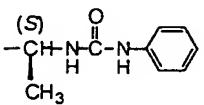
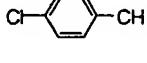
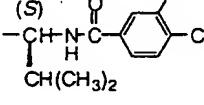
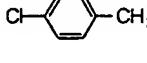
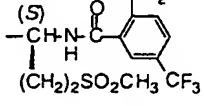
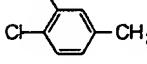
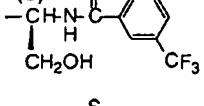
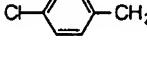
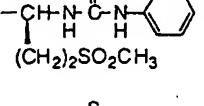
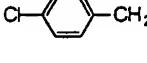
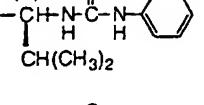
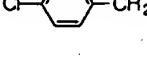
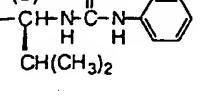
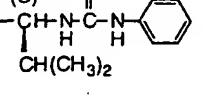
Compd. No.	$R_1$ $R_2$ ->(CH <sub>2</sub> ) <sub>j</sub> -	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(CH_2)_p-C(R^4)(R^5)-(CH_2)_q-G-R^6$
2311	H <sub>3</sub> CS- 	1	2	0	S	H	
2312	H <sub>3</sub> CS- 	1	2	0	R	H	
2313		1	2	0	R	H	
2314	H <sub>3</sub> CS- 	1	2	0	S	H	
2315		2	2	1	-	H	
2316		1	2	0	S	H	
2317		2	2	1	-	H	
2318		1	2	0	R	H	
2319		2	2	1	-	H	
2320		2	2	1	-	H	
2321	H <sub>3</sub> CS- 	2	2	1	-	H	

Table 1.212

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ ->(CH <sub>2</sub> ) <sub>i</sub> -	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -CH-N-C-S \\   \\ H \end{array}$ $\begin{array}{c} R^5 \\   \\ -CH_2- \\   \\ CH(CH_3)_2 \end{array}$ $-(CH_2)_q-G-R^6$
2322		2	2	1	-	H	
2323		2	2	1	-	H	
2324		2	2	1	-	H	
2325		1	2	0	R	H	
2326		1	2	0	R	H	
2327		1	2	0	R	H	
2328		1	2	0	S	H	
2329		1	2	0	S	H	
2330		1	2	0	S	H	
2331		1	2	0	S	H	
2332		1	2	0	R	H	

Table 1.213

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\   \\ R^2 \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---} \end{array}$	k	m	n	chirality	R <sup>3</sup>	$-(\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\   \\ R^5 \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2333	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	R	H	
2334	<chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	
2335	<chem>Clc1ccc(Cl)cc1C</chem>	1	2	0	S	H	
2336	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	
2337	<chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>	1	2	0	S	H	
2338	<chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	
2339	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	
2340	<chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	
2341	<chem>Clc1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	
2342	<chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)C</chem>	2	2	1	-	H	
2343	<chem>Clc1ccc(Cl)cc1C</chem>	2	2	1	-	H	

Table 1.214

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -CH-N-C(=O)- \\   \\ H \end{array}$ $\begin{array}{c} R^5 \\   \\ -(CH_2)_q-G-R^6 \end{array}$
2344		2	2	1	-	H	
2345		2	2	1	-	H	
2346		2	2	1	-	H	
2347		1	2	0	S	H	
2348		1	2	0	R	H	
2349		1	2	0	R	H	
2350		1	2	0	R	H	
2351		1	2	0	R	H	
2352		2	2	1	-	H	
2353		2	2	1	-	H	
2354		1	2	0	R	H	

Table 1.215

Compd. No.	$R^1$ $\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$R^4$ $R^5$ $-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{G}-\text{R}^6$
2355		1	2	0	R	H	
2356		1	2	0	R	H	
2357		1	2	0	R	H	
2358		1	2	0	R	H	
2359		1	2	0	R	H	
2360		1	2	0	R	H	
2361		1	2	0	R	H	
2362		1	2	0	R	H	
2363		2	2	1	-	H	
2364		2	2	1	-	H	
2365		2	2	1	-	H	

Table 1.216

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ - $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -CH-N-C(=O)- \\   \\ CH_3 \end{array}$ - $(CH_2)_q-G-R^6$
2366		2	2	1	-	H	
2367		2	2	1	-	H	
2368		2	2	1	-	H	
2369		2	2	1	-	H	
2370		2	2	1	-	H	
2371		2	2	1	-	H	
2372		2	2	1	-	H	
2373		2	2	1	-	H	
2374		2	2	1	-	H	
2375		2	2	1	-	H	
2376		2	2	1	-	H	

Table 1.217

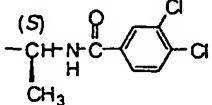
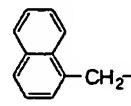
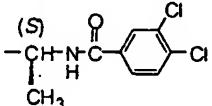
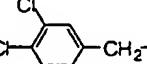
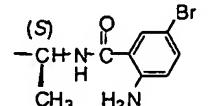
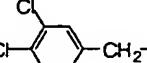
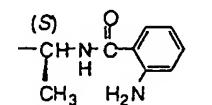
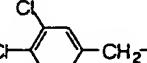
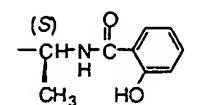
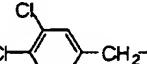
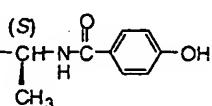
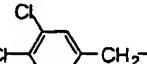
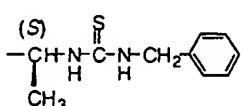
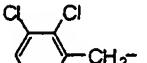
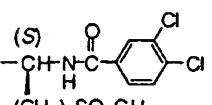
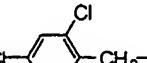
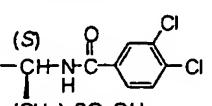
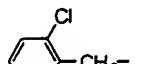
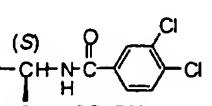
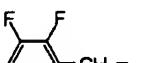
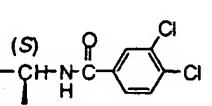
Compd. No.	$R^1$ $R^2>(CH_2)_l-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p-C(R^4)(R^5)-CH_2-G-R^6$
2377	F- 	2	2	1	-	H	
2378		2	2	1	-	H	
2379		2	2	1	-	H	
2380		2	2	1	-	H	
2381		2	2	1	-	H	
2382		2	2	1	-	H	
2383		2	2	1	-	H	
2384		1	2	0	R	H	
2385		1	2	0	R	H	
2386		1	2	0	R	H	
2387		1	2	0	R	H	

Table 1.218

Compd. No.	$R^1$ $R^2$	$\text{---}(\text{CH}_2)_i\text{---}$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}\text{---}(\text{CH}_2)_q\text{---}G\text{---}R^6$
2388			1	2	0	R	H	
2389			1	2	0	R	H	
2390			1	2	0	R	H	
2391			1	2	0	R	H	
2392			1	2	0	R	H	
2393			1	2	0	R	H	
2394			2	2	1	-	H	
2395			2	2	1	-	H	
2396			2	2	1	-	H	
2397			2	2	1	-	H	
2398			2	2	1	-	H	

Table 1.219

Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\text{C}(R^4)(R^5)-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
2399		2	2	1	-	H	
2400		2	2	1	-	H	
2401		2	2	1	-	H	
2402		2	2	1	-	H	
2403		2	2	1	-	H	
2404		2	2	1	-	H	
2405		2	2	1	-	H	
2406		2	2	1	-	H	
2407		2	2	1	-	H	
2408		2	2	1	-	H	
2409		2	2	1	-	H	

Table 1.220

Compd. No.	$R_1$ $R_2$ - $\text{C}(\text{H}_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(\text{CH}_2)_p-\overset{\text{R}^4}{\underset{\text{R}^5}{\text{C}}}-(\text{CH}_2)_q-\text{G}-\text{R}^6$
2410		2	2	1	-	H	
2411		2	2	1	-	H	
2412		2	2	1	-	H	
2413		2	2	1	-	H	
2414		2	2	1	-	H	
2415		2	2	1	-	H	
2416		2	2	1	-	H	
2417		2	2	1	-	H	
2418		2	2	1	-	H	
2419		2	2	1	-	H	
2420		2	2	1	-	H	

Table 1.221

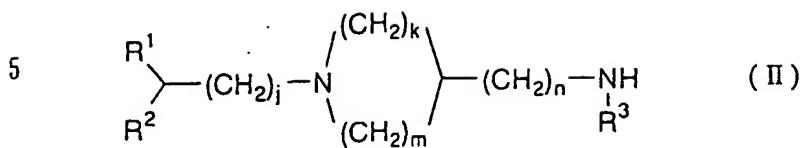
Compd. No.	$R^1$ $R^2$ - $(CH_2)_j-$	k	m	n	chirality	$R^3$	$-(CH_2)_p$ $\begin{array}{c} R^4 \\   \\ -C-N-C(H)-H \\   \\ CH_3 \end{array}$ $-(CH_2)_q-G-R^6$
2421		2	2	1	-	H	
2422		1	2	0	R	H	
2423		1	2	0	R	H	
2424		1	2	0	R	H	
2425		1	2	0	R	H	
2426		1	2	0	R	H	
2427		1	2	0	R	H	
2428		1	2	0	R	H	

本発明においては、環状アミン化合物の酸付加体も用いられる。かかる酸として、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、炭酸などの鉱酸；マレイン酸、クエン酸、リンゴ酸、酒石酸、フマル酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、蟻酸などの有機酸が挙げられる。

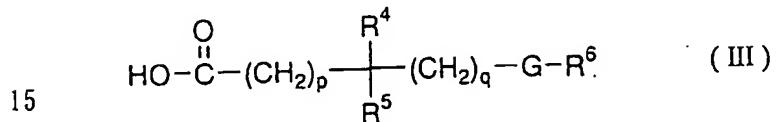
- 5 さらに、本発明においては、例えばヨウ化.1-(4-クロロベンジル)-1-メチル-4-[{N-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)グリシル}アミノメチル]ビペリジニウムのような、環状アミン化合物のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体も用いられる。ここで、アルキル基としては、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、n-ベ  
10 ンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、イソプロピル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、2-メチルペンチル、1-エチルブチルが好適な具体例として挙げられるが、特に好ましい例としては、メチル基、エチル基などが挙げられる。
- 15 また、アンモニウム陽イオンの対陰イオンの好適な具体例としては、フッ化物、塩化物、臭化物、またはヨウ化物などのハロゲン化物陰イオンを挙げることができる。
- 本発明においては、上記式(I)で表される化合物のラセミ体および可能なすべての光学活性体も用いることができる。
- 20 上記式(I)で表される化合物は、国際公開WO 9925686号に記載されているように、下記に示すいずれかの一般的な製造法を用いることにより合成することができる。

(製造法 1)

下記式 (II)



[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、j、k、m、およびnは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]  
 10 で表される化合物1当量と、下記式(III)



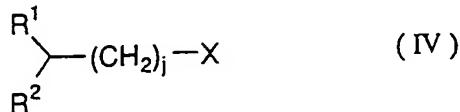
[式中、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、G、p、およびqは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]  
 20 で表されるカルボン酸、またはその反応性誘導体の0.1～1.0当量を無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。  
 上記式(III)で表されるカルボン酸の「反応性誘導体」とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの合成有機化学分野において通常使用される反応性の高いカルボン酸誘導体を意味する。  
 25 かかる反応は、適当量のモレキュラーシープなどの脱水剤；ジシクロヘキシリカルボジイミド(DCC)、N-エチル-N'-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDCIまたはWSC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、N-ヒドロキシサクシンイミド(HO  
 Su)、N-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBt)、ベンゾトリ  
 30 アゾール-1-イルオキシトリス(ピロリジノール)ホスホニウム=ヘキサフルオロホスフェート(PyBOP)、2-(1H-ベンゾトリア

ゾール-1-1イル) -1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=ヘキサフルオロホスフェート(HBTU)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボレート(TBTU)、2-(5-ノルボルネン-2, 3-ジカルボキシイミド)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボレート(TNTU)、O-(N-サクシニミジル)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボレート(TSTU)、プロモトリス(ピロリジノ)ホスホニウム=ヘキサフルオロホスフェート(PyBrōP)などの縮合剤; 炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジンなどのアミン類、(ビペリジノメチル)ポリスチレン、(モルホリノメチル)ポリスチレン、(ジメチルアミノメチル)ポリスチレン、ポリ(4-ビニルピリジン)などの高分子支持塩基などの塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

## (製造法2)

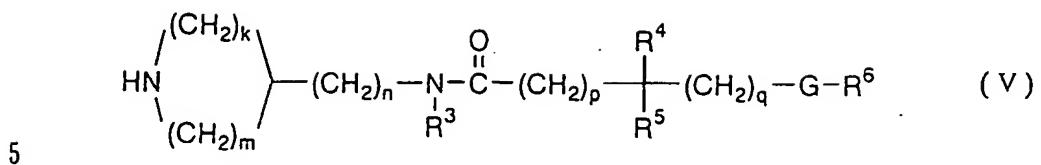
下記式(IV)

20



25 [式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、およびjは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じであり、Xはハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、またはアリールスルホニルオキシ基を表す。]

で表されるアルキル化試薬1当量と、下記式(V)



[式中、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{G}$ 、 $k$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $p$ 、および $q$ は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表される化合物0.1～1.0当量を無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

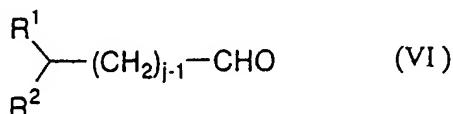
かかる反応は、上記製造法1と同様の塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。さらに、本製造方法においてヨウ化カリウム、ヨウ化ナトリウムなどのヨウ化物を共存させることにより、反応を促進できる場合がある。

15 上記式(IV)において、Xはハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、またはアリールスルホニルオキシ基を表す。かかるハロゲン原子としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が好ましく挙げられる。アルキルスルホニルオキシ基の好適な具体例としては、メチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基などが挙げられる。  
20 アリールスルホニルオキシ基の好適な具体例としては、トシリオキシ基を挙げることができる。

#### (製造法3)

下記式(VI)

25



30 [式中、 $\text{R}^1$ および $\text{R}^2$ は上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じであり、 $j$ は1または2を表す。]

または、下記式 (VII)



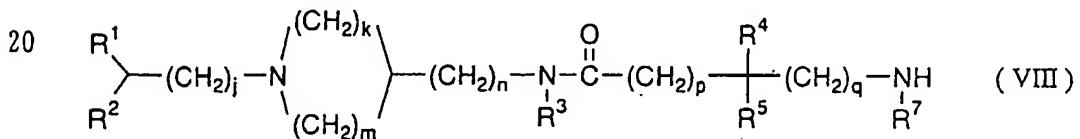
- 5 [式中、 $R^1$ は上記式 (I) における $R^1$ の定義と同じであり、 $j$ は0を表す場合に相当する。]

で表されるアルデヒド1当量と、上記式 (V) で表される化合物0.1～1.0当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

- 10 かかる反応は、一般に還元的アミノ化反応と呼ばれ、還元条件としては、パラジウム、白金、ニッケル、ロジウムなど金属を含む触媒を用いる接触水素添加反応、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムなどの複合水素化物およびボランを用いる水素化反応、また15は電解還元反応などを用いることができる。

(製造法4)

下記式 (VIII)



- 25 [式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$ 、 $j$ 、 $k$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $p$ 、および $q$ は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じである。] で表される化合物1当量と、下記式 (IX)



- 30 [式中、 $R^6$ は上記式 (I) における $R^6$ の定義と同じであり、Aはカルボニル基またはスルホニル基を表す。]

で表されるカルボン酸またはスルホン酸、またはそれらの反応性誘導体  
0.. 1 ~ 10 当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

上記式 (IX) で表されるカルボン酸またはスルホン酸の反応性誘導体  
5 とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの合成有機  
化学分野で一般に使用される反応性の高いカルボン酸またはスルホン酸  
誘導体を意味する。

かかる反応は、上記製造法 1 と同様の脱水剤、縮合剤、または塩基を  
適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

10

## (製造法 5)

上記式 (VIII) で表される化合物 1 当量と、下記式 (X)



15

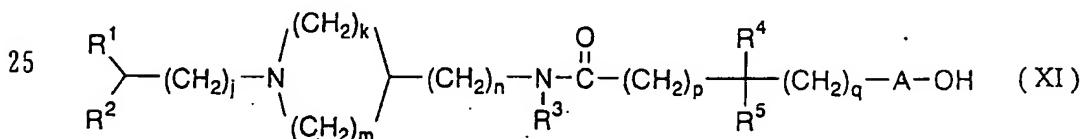
[式中、R<sup>6</sup>は上記式 (I) におけるR<sup>6</sup>の定義と同じであり、Zは酸  
素原子または硫黄原子を表す。]

で表されるイソシアネートまたはイソチオシアネート 0.. 1 ~ 10 当量  
を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

20

## (製造法 6)

下記式 (XI)



[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、j、k、m、n、p、およびqは、  
30 上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、Aはカルボニル基  
またはスルホニル基を表す。]

で表される化合物 1 当量と、下記式 (XII)



5 [式中、 $R^6$ は上記式 (I) における $R^6$ の定義と同じである。]

で表されるアミノ $O$ 。1～10当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

かかる反応は、上記製造法 1 と同様の脱水剤、縮合剤、または塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

10 上記製造法 1～6において、各反応に供する基質が、一般に有機合成化学において各反応条件において反応するか、あるいは反応に悪影響を及ぼすことが考えられる置換基を有する場合には、その官能基を既知の適当な保護基で保護して反応に供した後、既知の方法を用いて脱保護することにより目的の化合物を得ることができる。

15 さらに、本発明の化合物は、例えばアルキル化反応、アシル化反応、還元反応などの、一般に有機合成化学において使用される既知の反応を用いて、上記製造法 1～6 により製造される化合物の単数または複数の置換基をさらに変換することによっても得ることができる。

上記各製造法において、反応溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類、酢酸エチルなどのエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルなどの非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類などが反応に応じて適宜用いられる。

30 いずれの製造方法においても、反応温度は−78℃～+150℃、好ましくは0℃～100℃の範囲である。反応完了後、通常の単離、精製操作、すなわち濃縮、濾過、抽出、固相抽出、再結晶、クロマトグラフィーなどを行うことにより、目的とする上記式 (I) で表される環状アミン化合物を単離することができる。また、それらは通常の方法により、薬学的に許容される酸付加体またはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体に変換す

ることができる。

本発明のCCR5が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬の具体的な対象疾患としては、HIV（ヒト免疫不全ウイルス）の感染に起因する疾患、特にエイズ（後天性免疫不全症候群）、軟骨破壊または骨破壊を伴う疾患、特に慢性関節リウマチ、腎炎もしくは腎症、特に糸球体腎炎や間質性腎炎やネフローゼ症候群、脱髓疾患、特に多発性硬化症、臓器移植後の拒絶反応、移植片対宿主病（GVHD）、糖尿病、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、または炎症性腸疾患が挙げられる。

10

#### 実施例

本発明を以下、具体的に実施例に基づいて説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。以下の実施例において各化合物に付された化合物番号は、前記Table 1. 1～1. 2 15 21において好適な具体例として挙げた化合物に付された化合物番号（Compd. No.）と対応している。

[参考例1] (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン（化合物番号69）の合成

20 本発明の化合物はWO 99 25 686記載の製造法により合成したが、例えば化合物番号1606の(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジンは、以下のように合成した。

1) 3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩  
25 4-クロロベンジルクロリド(4.15g, 25.8mmol)とPr<sub>2</sub>NET(6.67g, 51.6mmol)を3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}ピロリジン(4.81g, 25.8mmol)のDMF溶液(50mL)に加えた。反応混合物を70℃で15時間攪拌し、溶媒を減圧下に除去した。再結晶(CH<sub>3</sub>CN, 50mL)により目的とする3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(6.43g, 80%)

を黄白色固体として得た。

- <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz) δ 1.37 (s, 9 H),  
 1.5-1.7 (br, 1 H), 2.1-2.4 (m, 2 H), 2.5-2.7 (m, 2 H),  
 2.83 (br, 1 H), 3.57 (s, 2 H), 4.1-4.3 (br, 1 H),  
 5 4.9-5.1 (br, 1 H), 7.15-7.35 (br, 4 H);  
 純度はRPLC/MSで求めた (98%) ; ESI/MS m/e  
 311.0 (M<sup>+</sup>+H, C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>)  
 3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン (6.38 g, 20.5 mmol) のCH<sub>3</sub>OH  
 10 H (80 mL) 溶液に1M HCl-Et<sub>2</sub>O (100 mL) を加え、25°Cで15時間攪拌した。溶媒を減圧下に除去し、固体を得、再結晶  
 (CH<sub>3</sub>OH : CH<sub>3</sub>CN = 1 : 2, 130 mL) で精製することにより、3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩  
 (4.939 g, 85%) を白色粉末として得た。  
 15 <sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, 300 MHz) δ 3.15 (br, 1 H),  
 3.3-3.75 (br-m, 4 H), 3.9 (br, 1 H), 4.05 (br, 1 H),  
 4.44 (br, 1 H), 4.54 (br, 1 H), 7.5-7.7 (m, 4 H),  
 8.45 (br, 1 H), 8.60 (br, 1 H);  
 純度はRPLC/MSで求めた (>99%) ; ESI/MS m/e  
 20 211.0 (M<sup>+</sup>+H, C<sub>11</sub>H<sub>16</sub>C1N<sub>2</sub>)  
 光学活性 (R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩と (S)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩を、それぞれ対応する原料を用いて上記の方法により合成した。生成物は、上記ラセミ体と同じ<sup>1</sup>H-NMRを示した。  
 25 2) (R)-3-{(N-tert-ブトキシカルボニル)グリシリル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン  
(R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩 (4.54 g, 16.0 mmol)、2M NaOH溶液 (80 mL)、および酢酸エチル (80 mL) の混合物を攪拌し、有機層を分離  
 30 し、水層を酢酸エチル (80 mL × 2) で抽出した。有機層をあわせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮することにより遊離の (R)-

3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.35g、9.9%)を得た。

(R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.35g、16mmol)のCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>(80mL)溶液に、Et<sub>3</sub>N(2.5mL、17.6mmol)、N-tert-ブトキシカルボニルグリシン(2.79g、16.0mmol)、EDCI(3.07g、16.0mmol)およびHOBT(12.16g、16mmol)を加えた。反応混合物を25℃で16時間攪拌した後、2M NaOH溶液(80mL)を加えた。有機層を分離し、水層をジクロロメタンで抽出した(100mL×3)。有機層をあわせて水(100mL×2)と食塩水(100mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO<sub>2</sub>、酢酸エチル)により、目的とする(R)-3-{N-(tert-ブトキシカルボニル)グリシル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(5.40g、92%)を得た。

### 3) (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-(グリシルアミノ)ピロリジンの合成

(R)-3-{N-(tert-ブトキシカルボニル)グリシル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(5.39g、14.7mmol)のメタノール(60mL)溶液に、4M HClジオキサン(38mL)溶液を加えた。この溶液を室温で2時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、2M NaOH溶液(80mL)を加えた。混合液をジクロロメタン(80mL×3)で抽出し、抽出液をあわせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO<sub>2</sub>、AcOH:EtOH:Et<sub>3</sub>N=90:5:5)により、(R)-3-(グリシルアミノ)-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.374g、86%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, 270MHz) δ  
 1.77 (dd, J = 1.3 および 6.9 Hz, 1H), 2.20-3.39 (m, 2H),  
 2.53 (dd, J = 3.3 および 9.6 Hz, 1H),  
 2.62 (dd, J = 6.6 および 9.6 Hz, 1H), 2.78-2.87 (m, 1H),

3.31 (s, 2 H), 3.57 (s, 2 H), 4.38-4.53 (br, 1 H),  
7.18-7.32 (m, 4 H), 7.39 (br, s, 1 H)

4) (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン(化

5 合物番号 1606)

3-(トリフルオロメチルチオ)安息香酸 (0.060 mmol)、  
(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-(グリシルアミノ)ピロリ  
ジン (0.050 mmol)、ジイソプロピルカルボジイミド (0.0  
60 mmol)、HOBt (0.060 mmol)、tert-ブタノ  
10 ール (0.15 mL)、クロロホルム (1.35 mL) の混合物を室温  
で 15 時間攪拌した。反応混合物を Varian™ SCX カラムに  
添加後、メタノール：クロロホルム = 1 : 1 (12 mL)、メタノール  
(12 mL) で順に洗浄した後、4 M アンモニアのメタノール溶液  
(5 mL) で溶出し、濃縮することにより、(R)-1-(4-クロロ  
15 ベンジル)-3-[{N-(3-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン(化合物番号 1606)を得た (1  
7.0 mg, 72%)：純度は RPLC/MS で求めた (97%)；  
ESI/MS m/e 472.0 ( $M^+ + H$ ,  $C_{21}H_{21}ClF_3N_3O_2S$ )

20

[実施例 1] [ $^{125}$ I] 標識 MIP-1 $\beta$  のCCR5 発現細胞膜画分への結合に対する化合物の阻害能の測定

ポリスチレン製 96 ウエルプレートに、被験化合物をアッセイバッフ  
ラー (50 mM HEPES, pH 7.4, 5 mM MgCl<sub>2</sub>, 1 m  
25 M CaCl<sub>2</sub>, 0.2% BSA) で希釈した溶液 20  $\mu$ L, [ $^{125}$   
I] 標識 MIP-1 $\beta$  (NEN Life Science Products, Inc.) を 0.1  
~ 0.5 nM になるようにアッセイバッファーで希釈した溶液 25  $\mu$ L,  
ヒト CCR5 を発現させた CHO 細胞膜画分を懸濁させた懸濁液 155  
30  $\mu$ L (膜画分 4  $\mu$ g を含む) をおのおの添加し (最終反応溶液量 200  
 $\mu$ L)、2 分間攪拌後、27°C で 60 分間インキュベートした。

反応終了後、反応液を Filtermate (パッカード社製) を用

いて濾過し、フィルターをあらかじめ冷した洗浄バッファー（10 mM HEPES、pH 7.4、0.5 M NaCl）250 μLで9回洗浄した。液体シンチレーターを1ウエルあたり50 μLずつ加え、放射活性をトップカウントNXT（パッカード社製）で測定した。

- 5 被験化合物の代わりにヒトMIP-1α 0.2 μMを添加したときのカウントを非特異的結合として差し引き、被験化合物を何も添加しないときのカウントを100%としてヒトMIP-1βのCCR5発現細胞膜画分への結合に対する被験化合物の阻害能を算出した。

$$10 \quad \text{阻害率 (\%)} = \{ 1 - (A - B) / (C - B) \} \times 100$$

（A：被験化合物添加時のカウント、B：非標識ヒトMIP-1α添加時のカウント、C：[<sup>125</sup>I] 標識ヒトMIP-1βのみ添加したときのカウント）

- 15 本発明の環状アミン誘導体の阻害能を測定したところ、例えば下記の化合物は、10 μMの濃度において、それぞれ20～50%、50%～80%、および>80%の阻害能を示した。

10 μMの濃度において20%～50%の阻害能を示した化合物：  
 化合物番号 132、198、490、516、521、528、529、  
 20 601、616、622、627、642、684、847、849、  
 850、857、867、874、899、902、1002、100  
 3、1057、1083、1189、1245、1247、1472、  
 1606、1859、1998、2093、2095、2097、21  
 34

25 10 μMの濃度において50%～80%の阻害能を示した化合物：  
 化合物番号 461、505、668、679、782、1042、10  
 73、1114、1559、1583、1609、1703、1718、  
 1783、1833、1836、1855、1917、2157、21  
 89、2251

30 10 μMの濃度において>80%の阻害能を示した化合物：  
 化合物番号 1709、1837、1910、1919、2179、22

35、2241

[実施例 2] HIV-1 の細胞への感染に対する化合物の阻害能の測定

HIV-1 の細胞への感染に対する化合物の阻害能は、CD4 と CCR5 を同時に発現している細胞、あるいはヒト末梢血単核球を用いて文献記載の方法に準じて実施した（例えば、Mack, M. et al., J. Exp. Med., 1998, 187, 1215; Baba, M. et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 1999, 96, 5698など参照）。

10 [実施例 3] 錠剤の製造

本発明で用いる化合物の錠剤は例えば下記処方により製造した。

本発明で用いる化合物	30 mg
ラクトース	87 mg
デンプン	30 mg
15 ステアリン酸マグネシウム	3 mg

[実施例 4] 注射剤の製造

本発明で用いる化合物の注射用溶液は例えば下記の処方により製造した。

20 本発明で用いる化合物の塩酸塩	30 mg
食塩	900 mg
注射用蒸留水	100 mL

## 産業上の利用可能性

25 本発明で用いられる環状アミン化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体は、CCR5拮抗剤であり、CCR5の生体内リガンドの標的細胞に対する作用を抑制する作用を有する。したがって、これらの化合物を有効成分として含有する薬剤は、CCR5が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬となる。

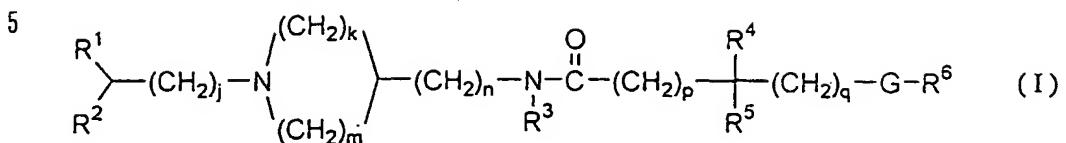
30 このような疾患としては、慢性関節リウマチ、腎炎（腎症）、多発性

硬化症、臓器移植後の拒絶反応、移植片対宿主病（G V H D）、糖尿病、慢性閉塞性肺疾患（C O P D）、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、および炎症性腸疾患など、単球／マクロファージ、T細胞などの組織への浸潤、活性化が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患が挙げられる。

また、本発明の薬剤は、C C R 5拮抗作用に基づくH I V - 1の宿主細胞への感染を阻害する作用により、エイズなどのH I V感染に起因する疾患の治療薬および／または治療薬としても有用である。

## 請求の範囲

## 1. 一般式



- 10 [式中、R<sup>1</sup>はフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記R<sup>1</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>（アルコキシカルボニル）メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ビペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式：-NH(C=O)O-で表される2価基、式：-NH(C=S)O-で表される2価基、アミノ基、モノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、またはジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基で置換されていてもよく、これらのフェニル基、
- 15
- 20
- 25
- 30

$C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、または $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基によって置換されていてもよい。

- 5  $R^2$  は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表し、 $R^2$  における $C_1 \sim C_6$  アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、または $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基によって置換されていてもよい。ただし、 $j = 0$  のときは、 $R^2$  はヒドロキシ基で  
10 はない。

$j$  は 0 ~ 2 の整数を表す。

$k$  は 0 ~ 2 の整数を表す。

$m$  は 2 ~ 4 の整数を表す。

$n$  は 0 または 1 を表す。

- 15  $R^3$  は、水素原子、または（それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基によって置換されていてもよい 1 または 2 個のフェニル基）によって置換されていてもよい  $C_1 \sim C_6$  アルキル基を表す。

- 16  $R^4$  および  $R^5$  は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、  
20 フェニル基、または $C_1 \sim C_6$  アルキル基を表し、 $R^4$  および  $R^5$  における $C_1 \sim C_6$  アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ基、（任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、  
25  $C_1 \sim C_6$  アルキル基、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基）、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$  アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$  アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ（ $C_1 \sim C_6$  アルキル）アミノ基、ジ（ $C_1 \sim C_6$  アルキル）アミノ基、または（ヘ

テロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、いっしょになって3～6員環状炭化水素を形成していてもよい。

5 pは0または1を表す。

qは0または1を表す。

Gは、-CO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-O-、-NR<sup>7</sup>-CO-、-CO-NR<sup>7</sup>-、-NH-CO-NH-、-NH-CS-NH-、-NR<sup>7</sup>-SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sup>7</sup>-、-NH-CO-O-、または-O-10 CO-NH-で表される基を表す。ここで、R<sup>7</sup>は、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基を表すか、あるいはR<sup>7</sup>はR<sup>5</sup>といっしょになってC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub>アルキレン基を形成していてもよい。

R<sup>6</sup>は、フェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、15 および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表し、上記R<sup>6</sup>におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記R<sup>6</sup>におけるフェニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、20 または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシル基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>25 シクロアルキルオキシ基、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルオキシ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルカノイルアミノ基、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>N-アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub>～30 C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N，N-ジ(C

$C_1 \sim C_6$  アルキル) スルファモイル基、アミノ基、モノ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ基、ジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ基、ベンジルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$  (アルコキシカルボニル) アミノ基、 $C_1 \sim C_6$  (アルキルスルホニル) アミノ基、またはビス ( $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル) アミノ基により置換されていてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$  アルキル基、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ基、 $10$  モノ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ基、またはジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ基によって置換されていてもよい。]  
で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$  アルキル付加体を有効成分とする、CCR5拮抗作用を有する薬剤。

15

2. 上記式 (I) において  $k = 1$  かつ  $m = 2$  である請求の範囲第1項記載のCCR5拮抗作用を有する薬剤。

20

3. 上記式 (I) において  $k = 0$  かつ  $m = 3$  である請求の範囲第1項記載のCCR5拮抗作用を有する薬剤。

4. 上記式 (I) において  $k = 1$  かつ  $m = 3$  である請求の範囲第1項記載のCCR5拮抗作用を有する薬剤。

25

5. 上記式 (I) において  $k = 2$  かつ  $m = 2$  である請求の範囲第1項記載のCCR5拮抗作用を有する薬剤。

6. 上記式 (I) において  $k = 1$  かつ  $m = 4$  である請求の範囲第1項記載のCCR5拮抗作用を有する薬剤。

30

7. 上記式 (I) で表される化合物、その薬学的に許容される酸付加

体、またはその薬学的に許容されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル付加体を有効成分とする、CCR5が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬。

8. CCR5が関与する疾患がヒト免疫不全ウイルスの感染に起因する疾患である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

9. ヒト免疫不全ウイルスの感染に起因する疾患が後天性免疫不全症候群である請求の範囲第8項記載の治療薬もしくは予防薬。

10 10. CCR5が関与する疾患が、軟骨破壊または骨破壊を伴う疾患である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

11. 軟骨破壊または骨破壊を伴う疾患が慢性関節リウマチである請求の範囲第10項記載の治療薬もしくは予防薬。

15 12. CCR5が関与する疾患が、腎炎もしくは腎症である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

20 13. 腎炎もしくは腎症が、糸球体腎炎、間質性腎炎、またはネフローゼ症候群である請求の範囲第12項記載の治療薬もしくは予防薬。

14. CCR5が関与する疾患が脱髓疾患である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

25 15. 脱髓疾患が多発性硬化症である請求の範囲第14項記載の治療薬もしくは予防薬。

16. CCR5が関与する疾患が臓器移植後の拒絶反応である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

30 17. CCR5が関与する疾患が移植片対宿主病である請求の範囲第

7 項記載の治療薬もしくは予防薬。

18. CCR5が関与する疾患が糖尿病である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

5

19. CCR5が関与する疾患が、慢性閉塞性肺疾患、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、サルコイドーシス、線維症、粥状動脈硬化症、乾癬、または炎症性腸疾患である請求の範囲第7項記載の治療薬もしくは予防薬。

10

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08627

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 Int.Cl<sup>7</sup> C07D207/09, C07D211/26, C07D405/12, C07D409/12, C07D401/12, C07D401/04, C07D409/14, C07D405/14, C07D401/14, C07D401/06, C07D413/06, C07D413/14, C07D409/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D207/09, C07D211/26, C07D405/12, C07D409/12, C07D401/12, C07D401/04, C07D409/14, C07D405/14, C07D401/14, C07D401/06, C07D413/06, C07D413/14, C07D409/06

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
 CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO, 99/25686, A (Teijin Limited), 27 May, 1999 (27.05.99), Claims, p1, p345-354 & EP, 1030840, A	1-7, 10-15, 19
Y	RAPORT. C. J. Molecular Cloning and Functional Characterization of a Novel Human CC Chemokine Receptor (CCR5) for RANTES, MIP-1 $\beta$ , and MIP-1 $\alpha$ . J. Biol. Chem., 1996, Vol.271, No.29, pages 17161-17166	1
Y	WO, 98/30218, A (SMITHKLEIN BEECHAM CORPORATION), 16 July, 1998 (16.07.98), Claims, p1, p15-16 & EP, 979078, A	8, 9
Y	MURAI. M. Active participation of CCR5 $^+$ CD8 $^+$ T lymphocytes in the pathogenesis of liver injury in graft-versus-host disease. J. Clin. Invest., July 1999, Vol.104, No.1, pages 49-57	17
Y	BALASHOV.K.E.CCR5 $^+$ and CXCR3 $^+$ T cells are increased in multiple sclerosis and their ligands MIP-1 $\alpha$ and IP-10 are	16, 18

Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 15 January, 2001 (15.01.01)	Date of mailing of the international search report 23 January, 2001 (23.01.01)
--	---

Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08627

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	expressed in demyelinating brain lesions. Proc. Natl. Acad. Sci. USA., June 1999, Vol. 96, No. 12, pages 6873-6878  WO, 99/01127, A (SMITHKLEIN BEECHAM CORPORATION), 14 January, 1999 (14.01.99), Claims, p1-4, p25-28 & EP, 1001766, A	19

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP00/08627

**Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (IPC)**

C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, C07D487/04 141, C07D403/06, C07D417/06, C07D513/04 331, C07D495/04 101, A61K31/40, A61K31/4025, A61K31/4545, A61K31/445, A61K31/454, A61K31/4525, A61K31/4535, A61K31/42, A61K31/422, A61K31/4155, A61K31/427, A61K31/53, A61K31/429, A61K31/4178, A61K31/381, A61K31/505, A61K31/4439, A61K31/4035, A61K31/428, A61K31/4245, A61P43/00 111, A61P29/00 101, A61P19/02, A61P13/12, A61P37/06, A61P21/00, A61P3/10, A61P11/00, A61P17/00, A61P9/10 101, A61P17/06, A61P1/04, A61P31/18

**Continuation of B. FIELDS SEARCHED (IPC)**

C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, C07D487/04 141, C07D403/06, C07D417/06, C07D513/04 331, C07D495/04 101, A61K31/40, A61K31/4025, A61K31/4545, A61K31/445, A61K31/454, A61K31/4525, A61K31/4535, A61K31/42, A61K31/422, A61K31/4155, A61K31/427, A61K31/53, A61K31/429, A61K31/4178, A61K31/381, A61K31/505, A61K31/4439, A61K31/4035, A61K31/428, A61K31/4245

## A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int cl' C07D 207/09, C07D 211/26, C07D 405/12, C07D 409/12, C07D 401/12, C07D 401/04, C07D 409/14, C07D 405/14, C07D 401/14, C07D 401/06, C07D 413/06, C07D 413/14, C07D 409/06

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int cl' C07D 207/09, C07D 211/26, C07D 405/12, C07D 409/12, C07D 401/12, C07D 401/04, C07D 409/14, C07D 405/14, C07D 401/14, C07D 401/06, C07D 413/06, C07D 413/14, C07D 409/06

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO, 99/25686, A (帝人株式会社) 27. 5月. 1999 (27. 05. 99) Claims, pl, p345-354 & EP, 1030840, A	1-7, 10-15, 19
Y	RAPORT. C. J. Molecular Cloning and Functional Characterization of a Novel Human CC Chemokine Receptor (CCR5) for RANTES, MIP-1 $\beta$ , and MIP-1 $\alpha$ . J. Biol. Chem., 1996, Vol. 271, No. 29, pages 17161-17166	1, 8, 9, 16-19
Y		1

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

## の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 15. 01. 01	国際調査報告の発送日 23.01.01
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官（権限のある職員） 内藤 伸一 4P 8615 電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C(続き) 関連すると認められる文献		関連する請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
Y	WO, 98/30218, A (SMITHKLEIN BEECHAM CORPORATION) 16. 7月. 1998 (16. 07. 98) Claims, p1, p15-16 & EP, 979078, A	8, 9
Y	MURAI. M. Active participation of CCR5 <sup>+</sup> CD8 <sup>+</sup> T lymphocytes in the pathogenesis of liver injury in graft-versus-host disease. J. Clin. Invest., July 1999, Vol. 104, No. 1, pages49-57	17
Y	BALASHOV. K. E. CCR5 <sup>+</sup> and CXCR3 <sup>+</sup> T cells are increased in multipl e sclerosis and their ligands MIP-1 $\alpha$ and IP-10 are expresse d in demyelinating brain lesions. Proc. Natl. Acad. Sci. USA., Jun e 1999, Vol. 96, No. 12, pages6873-6878	16, 18
Y	WO, 99/01127, A (SMITHKLEIN BEECHAM CORPORATION) 14. 1月. 1999 (14. 01. 99) Claims, p1-4, p25-28 & EP, 1001766, A	19

## A. の続き

C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, C07D487  
/04 141, C07D403/06, C07D417/06, C07D513/04  
331, C07D495/04 101, A61K31/40, A61K31/4025,  
A61K31/4545, A61K31/445, A61K31/454, A61K31/  
4525, A61K31/4535, A61K31/42, A61K31/422, A61  
K31/4155, A61K31/427, A61K31/53, A61K31/429,  
A61K31/4178, A61K31/381, A61K31/505, A61K31/  
4439, A61K31/4035, A61K31/428, A61K31/4245, A  
61P43/00 111, A61P29/00 101, A61P19/02, A61P  
13/12, A61P37/06, A61P21/00, A61P3/10, A61P11  
/00, A61P17/00, A61P9/10 101, A61P17/06, A61P  
1/04, A61P31/18

## B. の続き

C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, C07D487  
/04 141, C07D403/06, C07D417/06, C07D513/04  
331, C07D495/04 101, A61K31/40, A61K31/4025,  
A61K31/4545, A61K31/445, A61K31/454, A61K31/  
4525, A61K31/4535, A61K31/42, A61K31/422, A61  
K31/4155, A61K31/427, A61K31/53, A61K31/429,  
A61K31/4178, A61K31/381, A61K31/505, A61K31/  
4439, A61K31/4035, A61K31/428, A61K31/4245